

PCT

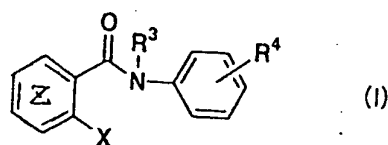
世界知的所有権機関
国際事務局

特許協力条約に基づいて公開された国際出願



(51) 国際特許分類6 C07D 213/89, 213/82, 239/26, 239/34, 239/42, 237/24, 239/52, A01N 43/54, 43/40, 43/58	A1	(11) 国際公開番号 WO99/44992 (43) 国際公開日 1999年9月10日(10.09.99)
(21) 国際出願番号 PCT/JP99/01048 (22) 国際出願日 1999年3月4日(04.03.99) (30) 優先権データ 特願平10/53485 1998年3月5日(05.03.98) 特願平10/165661 1998年6月12日(12.06.98) 特願平10/268025 1998年9月22日(22.09.98) (71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 日産化学工業株式会社 (NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.)(JP/J) 〒101-0054 東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1 Tokyo, (JP) (72) 発明者 ; および (75) 発明者 / 出願人 (米国についてのみ) 秋山茂明(AKIYAMA, Shigeaki)(JP/J) 近藤康夫(KONDO, Yasuo)(JP/J) 安達倫明(ADACHI, Michiaki)(JP/J) 水越隆司(MIZUKOSHI, Takashi)(JP/J) 〒274-8507 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社 中央研究所内 Chiba, (JP) 渡邊重臣(WATANABE, Shigeomi)(JP/J) 秋吉千秋(AKIYOSHI, Chiaki)(JP/J)	大木 亨(OHKI, Tooru)(JP/J) 中平国光(NAKAHIRA, Kunimitsu)(JP/J) 〒349-0218 埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama, (JP) (74) 代理人 弁理士 小川利春, 外(OGAWA, Toshiharu et al.) 〒101-0042 東京都千代田区神田東松下町38番地 島本鋼業ビル Tokyo, (JP) (81) 指定国 AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM) 添付公開書類 国際調査報告書	
(54)Title: ANILIDE COMPOUNDS AND HERBICIDE (54)発明の名称 アニライド化合物及び除草剤 <div data-bbox="503 1260 1055 1512"><p>(I)</p></div> (57) Abstract Compounds represented by formula (I) or salts thereof, which are useful as a herbicide, wherein ring Z represents 3,4-substituted pyridine, pyrimidine, or pyrazine which are optionally substituted with alkyl, etc.; R ³ represents H, C ₁₋₆ alkyl, (substituted) phenylalkyl, etc.; R ⁴ represents H, halogeno, nitro, cyano, C ₁₋₆ alkyl, etc.; and X represents alkoxycarbonyl, alkylaminoaminocarbonyl, cyano, alkylcarbonyl, (substituted) oxadiazolyl, etc.		

(57)要約



[式中、環 Z は、3,4-置換ピリジン、ピリミジン、ピラジンであり、これらは、さらにアルキル等で置換されていてもよく、R³は、H、C₁~C₆アルキル、(置換)フェニルアルキル等、R⁴は、H、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁~C₆アルキル等、Xはアルコキシカルボニル、アルキルアミノアミノカルボニル、シアノ、アルキルカルボニル、(置換)オキサジアゾリル等を示す。]で表される化合物またはその塩は、除草剤として有用である。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

AE アラブ首長国連邦	DM ドミニカ	KZ カザフスタン	SD スーダン
AL アルバニア	EE エストニア	LC セントルシア	SE スウェーデン
AM アルメニア	ES スペイン	LI リヒテンシュタイン	SG シンガポール
AT オーストリア	FI フィンランド	LK スリ・ランカ	SI スロヴェニア
AU オーストラリア	FR フランス	LR リベリア	SK スロヴァキア
AZ アゼルバイジャン	GA ガボン	LS レソト	SL シェラ・レオネ
BA ボスニア・ヘルツェゴビナ	GB 英国	LT リトアニア	SN セネガル
BB バルバドス	GD グレナダ	LU ルクセンブルグ	SZ スワジランド
BE ベルギー	GE グルジア	LV ラトヴィア	TD チャード
BF ブルキナ・ファソ	GH ガーナ	MC モナコ	TG トーゴ
BG ブルガリア	GM ガンビア	MD モルドヴァ	TJ タジキスタン
BJ ベナン	GN ギニア	MG マダガスカル	TZ タンザニア
BR ブラジル	GW ギニア・ビサウ	MK マケドニア旧ユーゴスラヴィア	TM トルクメニスタン
BY ベラルーシ	GR ギリシャ	共和国	TR トルコ
CA カナダ	HR クロアチア	ML マリ	TT トリニダード・トバゴ
CF 中央アフリカ	HU ハンガリー	MN モンゴル	UA ウクライナ
CG コンゴ	ID インドネシア	MR モリタニア	UG ウガンダ
CH スイス	IE アイルランド	MW マラウイ	US 米国
CI コートジボアール	IL イスラエル	MX メキシコ	UZ ウズベキスタン
CM カメルーン	IN インド	NE ニジェール	VN ヴィエトナム
CN 中国	IS アイスランド	NL オランダ	YU ユーゴスラビア
CR コスタ・リカ	IT イタリア	NO ノールウェー	ZA 南アフリカ共和国
CU キューバ	JP 日本	NZ ニュー・ジーランド	ZW ジンバブエ
CY キプロス	KE ケニア	PL ポーランド	
CZ チェッコ	KG キルギスタン	PT ポルトガル	
DE ドイツ	KP 北朝鮮	RO ルーマニア	
DK デンマーク	KR 韓国	RU ロシア	

明細書

アニライド化合物及び除草剤

技術分野

本発明は、アニライド化合物及びそれを有効成分として含有する除草剤に関するものである。

背景技術

従来から、重要作物、例えば大豆、トウモロコシ、小麦、棉、イネ、ビート等を雑草害から守り、これらの重要作物の生産性を高める為に多くの除草剤が実用化されてきたが、依然として既存の薬剤は求められる機能をすべて満たしているものではない。

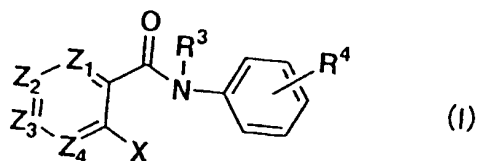
ところで、特開昭63-198670号公報には、ある種のピリミジン-5-カルボン酸アニライド化合物が、植物成長抑制作用を有することが開示されている。しかし、ピリミジン環4位の置換基として、例えばエステル基、アミド基、シアノ基、アシル基などを有するピリミジン-5-カルボン酸アニライド化合物に関しては、開示されていない。

また、特開平9-323974号公報には、ある種のピリジン3-カルボン酸アニライド化合物が除草作用を有することが開示されている。しかし、ピリジン環2位の置換基として、水素原子、アルキル基、アルコキシ基、アルキルチオ基などを有するピリジン3-カルボン酸アニライド化合物に関しては開示されていない。

発明の開示

本発明者らは、新規な酸アニライド化合物の除草作用について鋭意検討した結果、下記式で示される本発明化合物が優れた除草作用を有することを見出し、本発明を完成するに至った。

即ち、本発明は式 (I) :



[式中、 $=Z^1 \sim Z^4 =$ は $=C(R^2) - C(R^{22}) = N - N =$ 、 $=C(R^2) - N = C(R^1) - C(R^{23}) =$ 、 $=C(R^2) - N(\rightarrow O) = C(R^1) - C(R^{23}) =$ 、 $=C(R^2) - N = C(R^1) - N =$ 、 $=C(R^2) - N = N - C(R^{23}) =$ 、 $=N - N = C(R^1) - C(R^{23}) =$ 又は $=N - C(R^{22}) = N - C(R^{23}) =$ を表わし、

R^1 、 R^2 、 R^{22} 及び R^{23} は同一でも相異なってもよく、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル基、Aで置換されていてもよいフェニル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニル $C_2 \sim C_4$ アルケニル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニル $C_2 \sim C_4$ アルキニル基、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $-CO_2R^7$ 基、 $-(C(R^5)R^6) - CO_2R^7$ 基、 $-(C(R^5)R^6)_2 - CO_2R^7$ 基、 $-(C(R^5)R^6)_3 - CO_2R^7$ 基、 $-(C(R^5)R^6)_4 - CO_2R^7$ 基、 $-CN$ 基、 $-(C(R^5)R^6) - CN$ 基、 $-(C(R^5)R^6)_2 - CN$ 基、 $-(C(R^5)R^6)_3 - CN$ 基、 $-(C(R^5)R^6)_4 - CN$ 基、 $-N(R^8)R^9$ 基、 $-(C(R^5)R^6) - N(R^8)R^9$ 基、 $-(C(R^5)R^6)_2 - N(R^8)R^9$ 基、 $-(C(R^5)R^6)_3 - N(R^8)R^9$ 基、 $-(C(R^5)R^6)_4 - N(R^8)R^9$ 基、 $-L-R$

¹⁰基、C₁~C₆アルキルカルボニル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニルC₁~C₄アルキルカルボニル基、C₁~C₆ジアルキルカルバモイル基、C₁~C₆アルキルスルホニル基又は、C₁~C₆ジアルキルスルファモイル基を表わし、

R³は水素原子、C₁~C₆アルキル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニルC₁~C₄アルキル基、C₁~C₆アルキルカルボニル基、フェニル基がAで置換されていてもよいベンゾイル基、C₁~C₆アルコキシC₁~C₆アルキル基又はC₁~C₆アルコキシカルボニル基を表わし、

Aは水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、C₁~C₆アルキル基、C₁~C₆ハロアルキル基、C₁~C₆アルコキシ基、C₁~C₆ハロアルコキシ基、C₁~C₆アルコキシカルボニル基、C₁~C₆アルキルカルボニル基、フェニル基、フェノキシ基、ベンジル基、C₁~C₄アルキルカルボニルアミノ基、C₁~C₄アルコキシカルボニルアミノ基、C₁~C₆アルキルチオ基及びC₁~C₆アルキルスルホニル基から選ばれる同一又は相異なった1以上の基を表わし、

R⁴は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、C₁~C₆アルキル基、C₁~C₆ハロアルキル基、C₁~C₆アルコキシ基、C₁~C₆ハロアルコキシ基、C₁~C₆アルコキシカルボニル基、C₁~C₆アルキルカルボニル基、フェニル基、フェノキシ基、ベンジル基、C₁~C₄アルキルカルボニルアミノ基、C₁~C₄アルコキシカルボニルアミノ基、C₁~C₆アルキルチオ基及びC₁~C₆アルキルスルホニル基から選ばれる同一又は相異なった1以上の基を表わし、

R⁵及びR⁶は同一でも相異なってもよく、水素原子又はC₁~C₄アルキル基を表わし、

R⁷は水素原子、C₁~C₆アルキル基又はC₁~C₆シクロアルキル基を表わし、

R⁸及びR⁹は同一でも相異なってもよく、水素原子、C₁~C₁₀アルキル基、C₂~C₁₀アルケニル基、C₂~C₁₀アルキニル基、C₁~C₁₀ハロアルキル基、C₂~C₁₀ハロアルケニル基、C₂~C₁₀ハロアルキニル基、C₃~C₁₀シクロアルキル基、C₃~C₁₀ハロシクロアルキル基、C₁~C₆アルコキシC₁~C₆アルキル基、C₁~C₆アルキルチオC₁~C₆アルキル基、C₁~C₄アルキルカルボニル基、C₁~C₄アルコキシカルボニル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニ

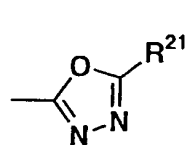
ル $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル基、シアノ基、フェニル基が A で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基、フェニル基が A で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_4$ アルケニル基、フェニル基が A で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_4$ アルキニル基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基又は $C_1 \sim C_4$ ジアルキルスルファモイル基を表わし、

R^8 及び R^9 は結合する窒素原子とともに 3 ~ 9 員環を形成していてもよく、1 若しくは 2 の酸素原子又は 1 若しくは 2 の硫黄原子を含む 5 ~ 8 員環を形成していてもよく、

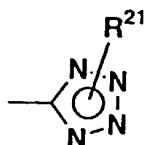
L は酸素原子又はイオウ原子を表わし、

R^{10} は水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $-\text{CO}_2R^7$ 基、 $-(C(R^5)R^6)-\text{CO}_2R^7$ 基、 $-(C(R^5)R^6)_2-\text{CO}_2R^7$ 基、 $-(C(R^5)R^6)_3-\text{CO}_2R^7$ 基、 $-(C(R^5)R^6)_4-\text{CO}_2R^7$ 基、A で置換されていてもよいフェニル基、A で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $-\text{CON}(R^8)R^9$ 基、 $-(C(R^5)R^6)-\text{CON}(R^8)R^9$ 基、 $-(C(R^5)R^6)_2-\text{CON}(R^8)R^9$ 基、 $-(C(R^5)R^6)_3-\text{CON}(R^8)R^9$ 基又は $-(C(R^5)R^6)_4-\text{CON}(R^8)R^9$ 基を表わし、

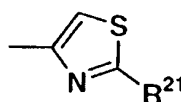
X は $-\text{CO}-\text{L}-R^{11}$ 基、 $-\text{C}(=\text{L})\text{N}(R^{12})R^{13}$ 基、 $-\text{C}(=\text{L})-\text{N}(R^{12})-\text{OR}^{13}$ 基、 $-\text{C}(=\text{L})\text{N}(R^{14})-\text{N}(R^{12})R^{13}$ 基、 $-\text{C}(=\text{L})\text{N}(R^{15})-\text{CO}_2R^{18}$ 基、 $-\text{C}(=\text{L})\text{N}(R^{15})-(C(R^{16})R^{17})-\text{CO}_2R^{18}$ 基、 $-\text{C}(=\text{L})\text{N}(R^{15})-(C(R^{16})R^{17})_2-\text{CO}_2R^{18}$ 基、 $-\text{C}(=\text{L})\text{N}(R^{15})-(C(R^{16})R^{17})_3-\text{CO}_2R^{18}$ 基、 $-\text{C}(R^{19})=\text{N}-\text{O}-R^{20}$ 基、 $-\text{C}(=\text{L})\text{NH}-\text{G}$ 基、シアノ基、 $-\text{CO}-R^{19}$ 基、J (a), J (b), J (c) 又は J (d)



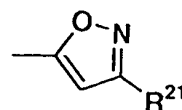
J(a)



J(b)



J(c)



J(d)

を表わし、

R^{11} は水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル基、Aで置換されていてもよいフェニル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基を表わし、

R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} は同一でも相異なってもよく、水素原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル基、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル基、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル基、 $C_2 \sim C_{10}$ ハロアルケニル基、 $C_2 \sim C_{10}$ ハロアルキニル基、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル基、ヒドロキシ $C_1 \sim C_{10}$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル基、シアノ基、Aで置換されていてもよいフェニル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_4$ アルケニル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_4$ アルキニル基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基又は $C_1 \sim C_4$ ジアルキルスルファモイル基を表わし、

R^{12} 及び R^{13} は結合する窒素原子又は酸素原子とともに3～9員環を形成してもよく、1若しくは2の酸素原子又は若しくは2の硫黄原子を含む5～8員環を形成してもよく、

R^{16} 及び R^{17} は同一でも相異なってもよく、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル

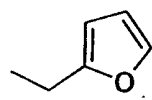
基、Aで置換されていてもよいフェニル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニルC₁~C₄アルキル基又はC₁~C₄アルキルチオC₁~C₄アルキル基を表わし、

R¹⁶及びR¹⁷は結合する炭素原子とともに4~9員環を形成していてもよく、
R¹⁸は水素原子又はC₁~C₄アルキル基を表わし、

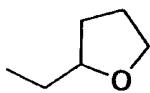
R¹⁹は水素原子、C₁~C₆アルキル基、C₃~C₆シクロアルキル基、C₁~C₆ハロアルキル基、C₂~C₆アルケニル基、C₂~C₆アルキニル基、Aで置換されていてもよいフェニル基又はフェニル基がAで置換されていてもよいフェニルC₁~C₄アルキル基を表わし、

R²⁰は水素原子、C₁~C₆アルキル基、C₂~C₆アルケニル基、C₂~C₆ハロアルケニル基、C₂~C₆アルキニル基、シアノC₁~C₆アルキル基、C₁~C₆アルコキシC₁~C₆アルキル基又はC₁~C₆アルキルチオC₁~C₆アルキル基を表わし、

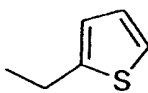
GはG(a), G(b), G(c)又はG(d)のいずれかの構造



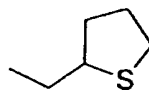
G(a)



G(b)



G(c)



G(d)

を表わし、

R²¹は水素原子、C₁~C₆アルキル基又はC₁~C₆シクロアルキル基を表わす。]で示される新規なアニライド化合物(以下、本発明化合物を称す)及びその塩、そしてそれらを有効成分として含有することを特徴とする農薬、特に除草剤に関するものである。但し、以上の化合物に光学異性体、ジマステレオマー、幾何異性体が存在する場合は、それぞれの混合物及び単離された双方を包含する。

発明を実施するための最良の形態

本発明のアニライド化合物の一般式(I)において、=Z¹~Z⁴=の結合様式としては、=C(R²)-C(R²²)=N-N=、=C(R²)-N=C(R¹)-

$C(R^{23}) =, = C(R^2) - N(\rightarrow O) = C(R^1) - C(R^{23}) =, = C(R^2) - N = C(R^1) - N =, = C(R^2) - N = N - C(R^{23}) =, = N - N = C(R^1) - C(R^{23}) =$ 又は $= N - C(R^2) = N - C(R^{23}) =$ の結合様式が挙げられ、好ましくは、 $= C(R^2) - N = C(R^1) - C(R^{23}) =, = C(R^2) - N = C(R^1) - N =$ 又は $= C(R^2) - C(R^{22}) = N - N =$ の結合様式が挙げられる。

R^1 , R^2 , R^{22} 及び R^{23} としては、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、*i*-プロピル基、*i*-ブチル基、*t*-ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、トリクロロメチル基、トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、ジフルオロクロロメチル基、フルオロメチル基、フルオロエチル基、トリフルオロエチル基、フルオロプロピル基、ビニル基、アリル基、クロチル基、メタリル基、3-クロロアリル基、エチニル基、プロパルギル基、1-メチルプロパルギル基、3-メチルプロパルギル基、3-クロロプロパルギル基、フェニル基、ベンジル基、2-フェニルエチル基、1-フェニルエチル基、スチリル基、シンナミル基、2-フェニルエチニル基、塩素原子、臭素原子、フッ素原子、シアノ基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、メトキシエチル基、エトキシエチル基、メトキシジフルオロメチル基、メチルチオメチル基、エチルチオメチル基、メチルチオジフルオロメチル基、アセチル基、ベンゾイル基、ジメチルカルバモイル基、メタンスルホニル基、エタンスルホニル基、ジメチルスルファモイル基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、ヘキサメチレンイミノ基又はモルホリノ基が挙げられ、好ましくは水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、*i*-プロピル基、*i*-ブチル基、シクロプロピル基、トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、フェニル基、塩素原子、フッ素原子、シアノ基、メトキシメチル基、メチルチオメチル基、メタンスルホニル基又はピロリジノ基が挙げられる。

R^3 としては水素原子、メチル基、エチル基、イソプロピル基、ベンジル基、アセチル基、ピバロイル基、ベンゾイル基、4-メトキシベンゾイル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、メトキシカルボニル基又はエトキシカルボニル基が挙げられ、好ましくは、水素原子、ピバロイル基、4-メトキシベンゾイル基

又はエトキシカルボニル基が挙げられる。

Aとしては、水素原子、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、ヨウ素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、*i*-プロピル基、*i*-ブチル基、*t*-ブチル基、トリクロロメチル基、トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、メトキシ基、エトキシ基、トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、アセチル基、フェニル基、フェノキシ基、ベンジル基、アセチルアミノ基、メトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、メチルチオ基又はメタンスルホニル基が挙げられ、好ましくは水素原子、塩素原子、フッ素原子、シアノ基、メチル基、エチル基、トリフルオロメチル基、メトキシ基又はメチルチオ基が挙げられる。

Aの置換位置としては、フェニル基が結合した位置に対して2位、3位又は4位が挙げられ、好ましくは、2位又は4位が挙げられる。

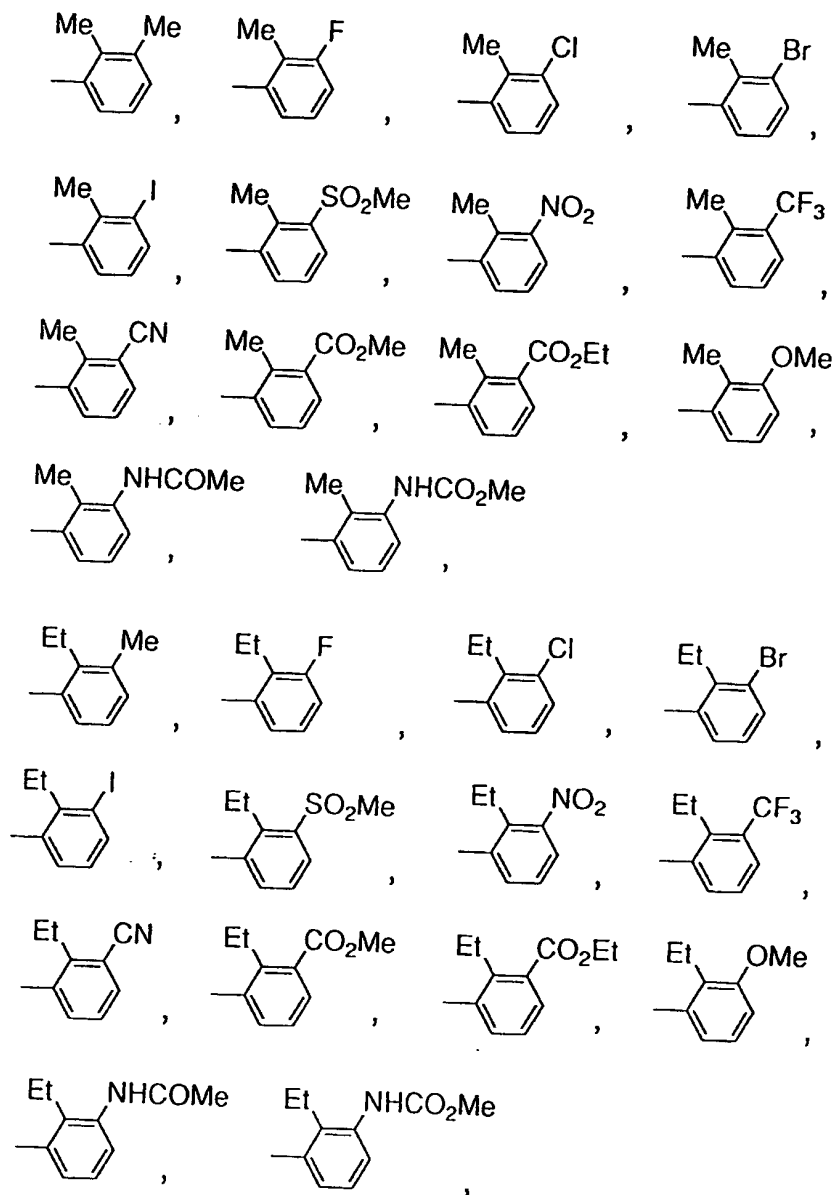
Aの置換する数としては1ないし5の整数が挙げられ、好ましくは1，2又は3が挙げられる。

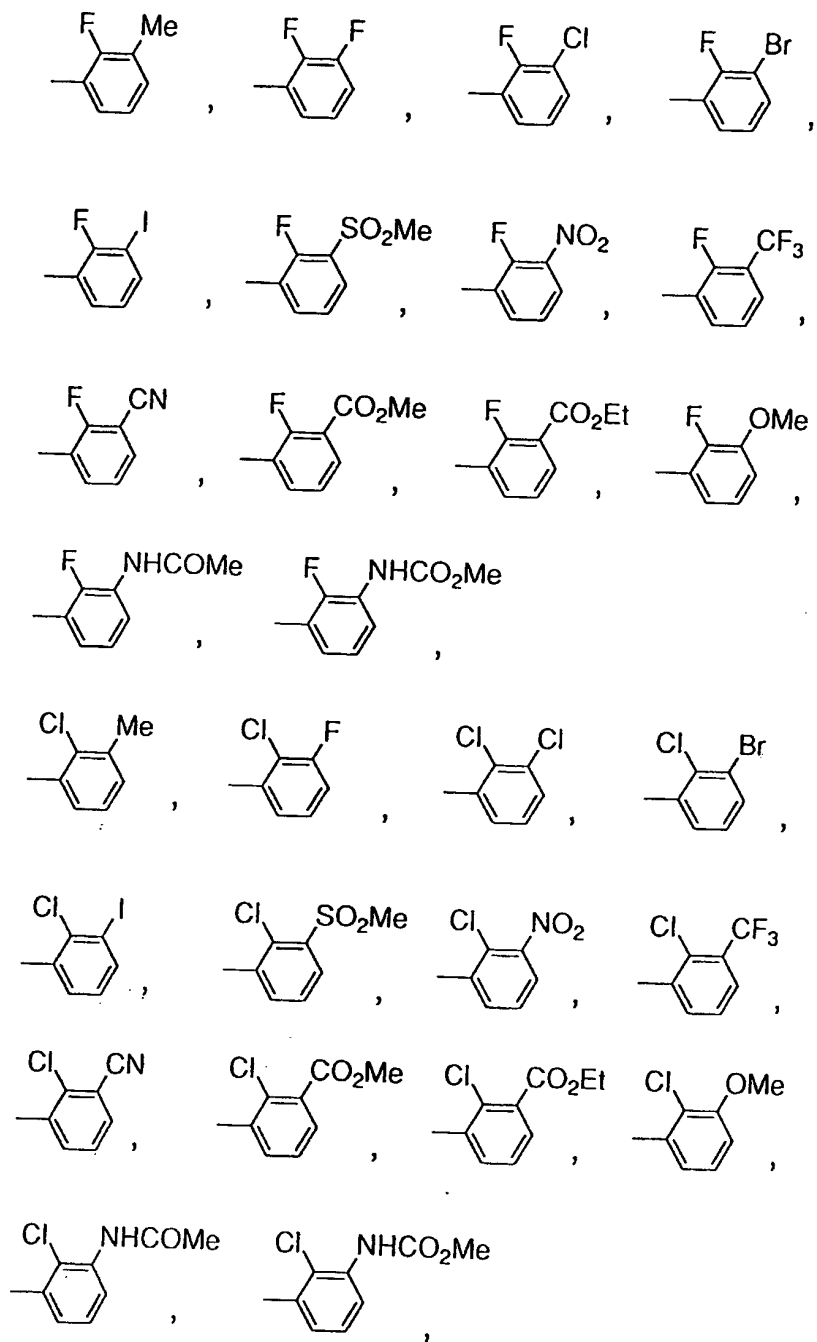
1置換のR¹としては、例えば水素原子、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、ヨウ素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、*i*-プロピル基、*t*-ブチル基、トリクロロメチル基、トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、メトキシ基、エトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、アセチル基、フェニル基、フェノキシ基、ベンジル基、アセチルアミノ基、メトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、メチルチオ基又はメタンスルホニル基が挙げられ、好ましくは、水素原子、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、ヨウ素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、*i*-プロピル基、*t*-ブチル基、トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、メトキシ基、エトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、アセチル基、フェニル基、フェノキシ基、ベンジル基、アセチルアミノ基、メトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、メチルチオ基又はメタンスルホニル基が挙げられる。

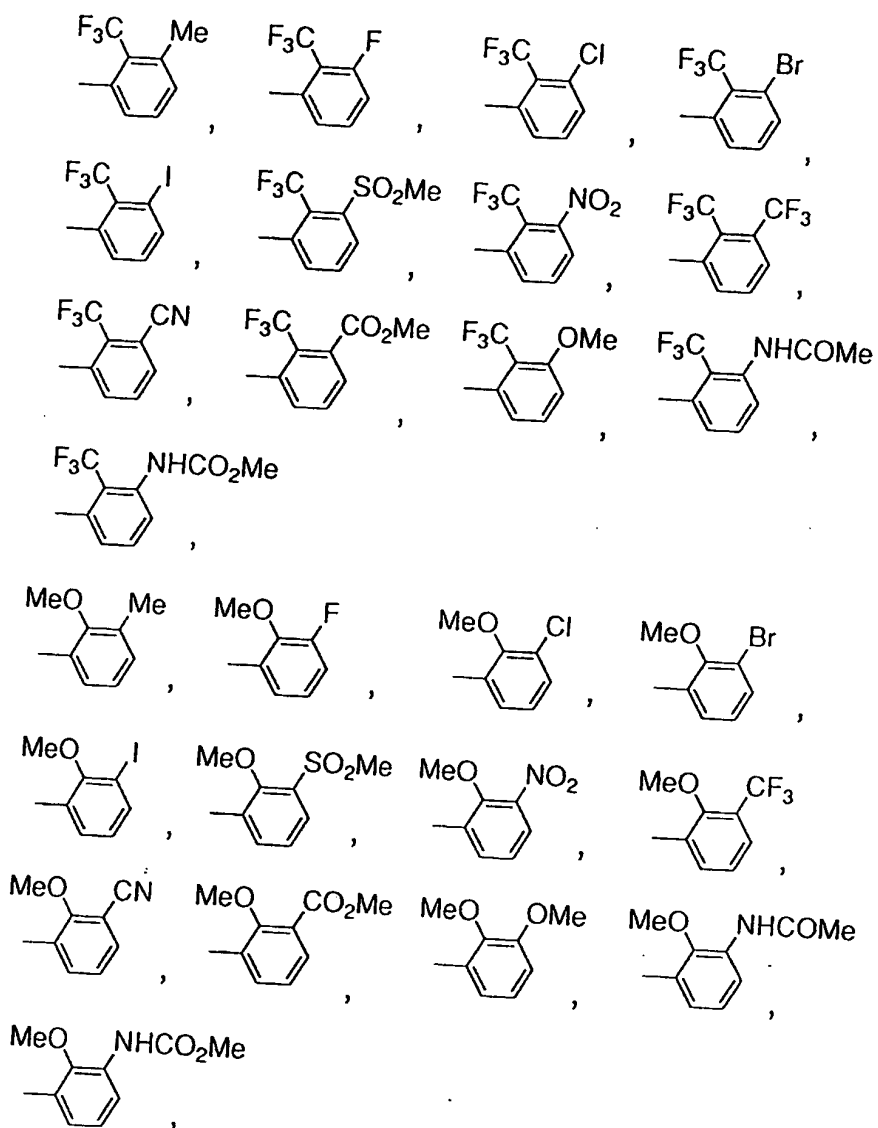
またR¹の置換位置としてはアニライド結合に対して2位、3位又は4位が挙げ

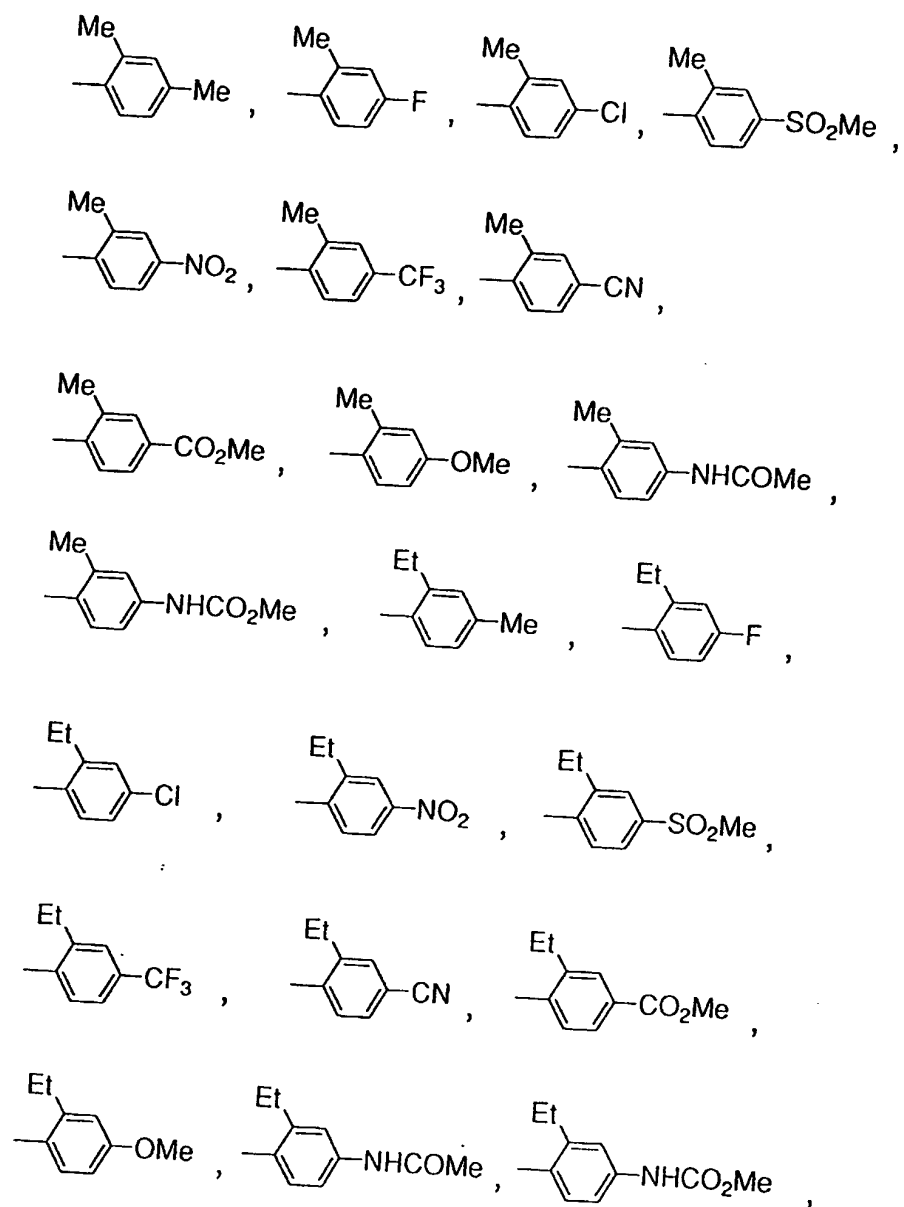
られ、好ましくは2位又は4位が挙げられる。

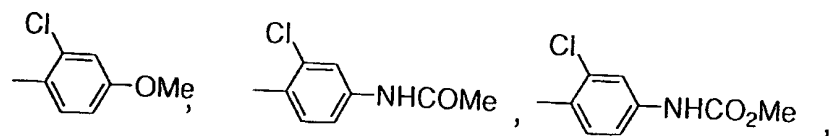
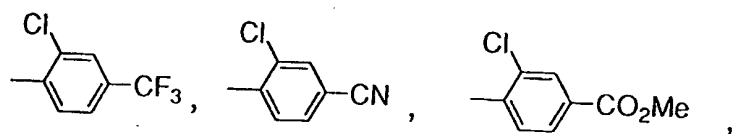
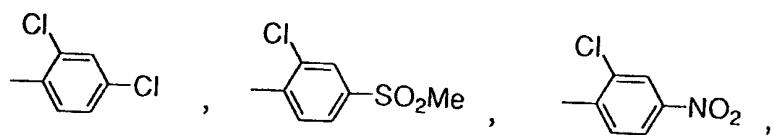
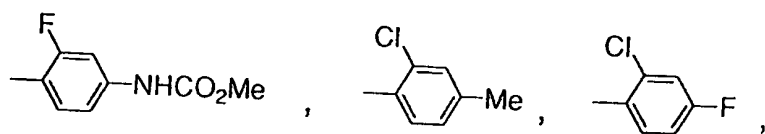
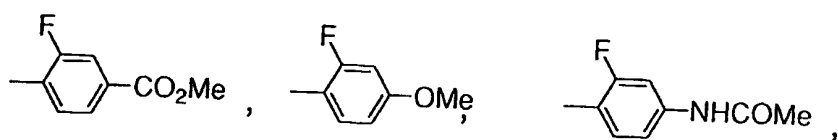
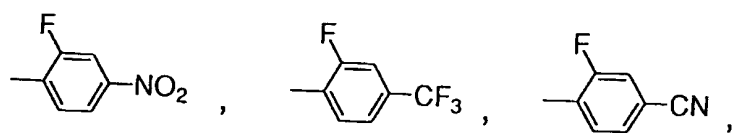
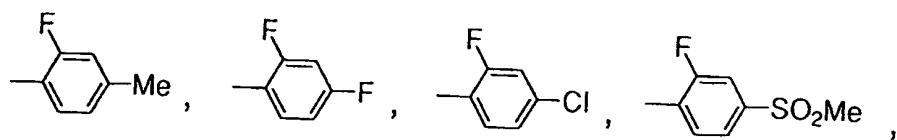
2置換ないし5置換のR'としては例えば以下に示すものが挙げられる。

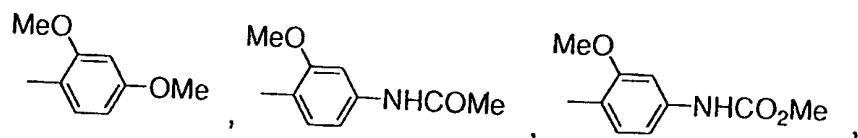
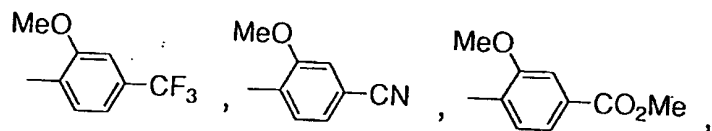
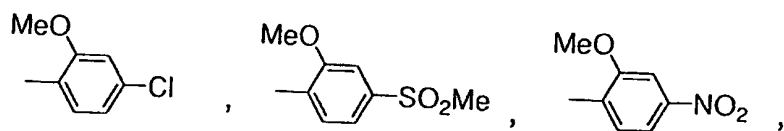
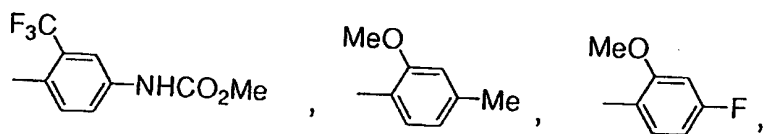
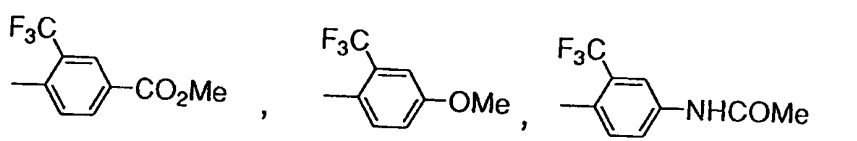
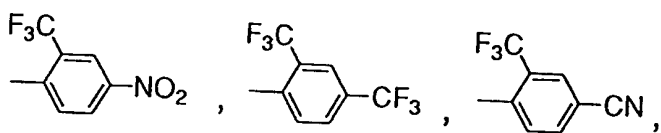
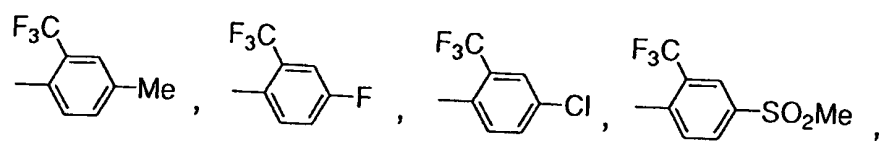


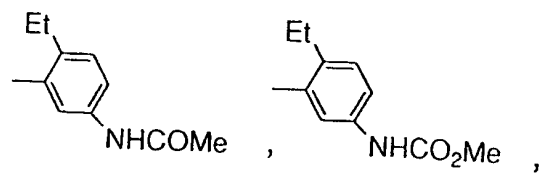
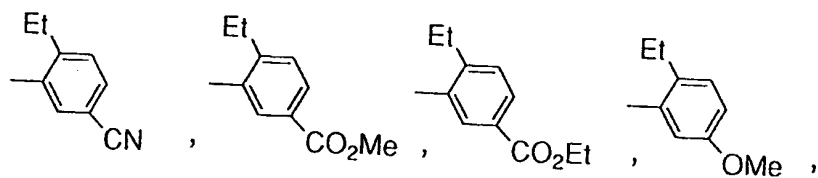
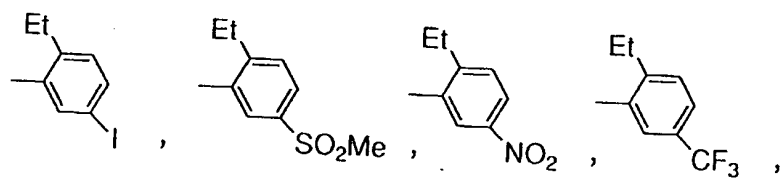
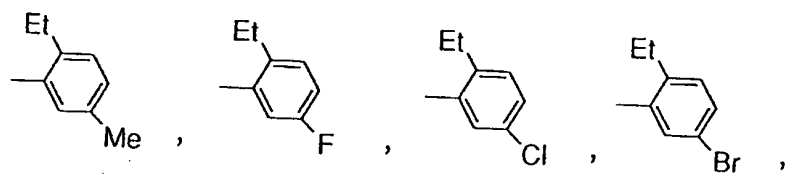
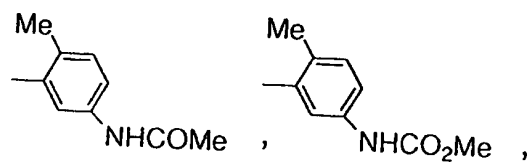
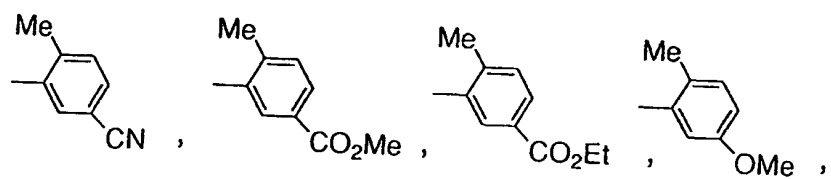
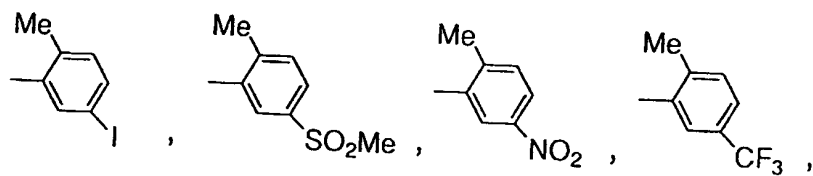
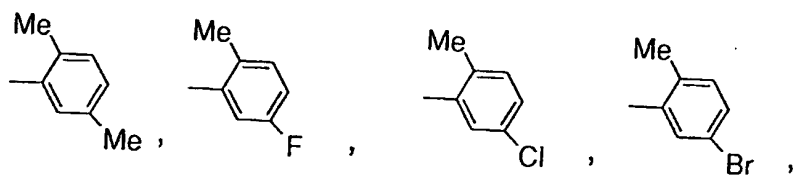


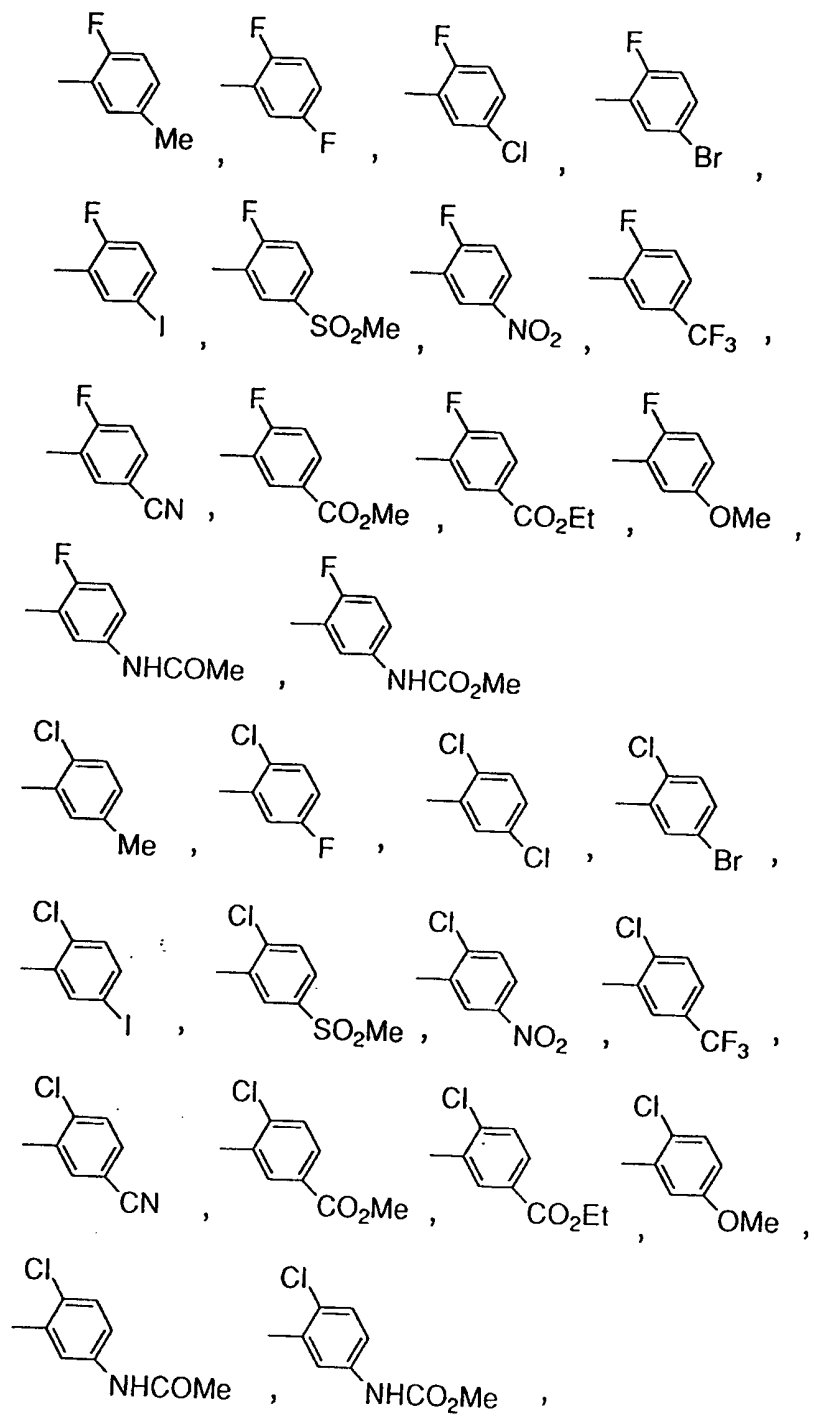


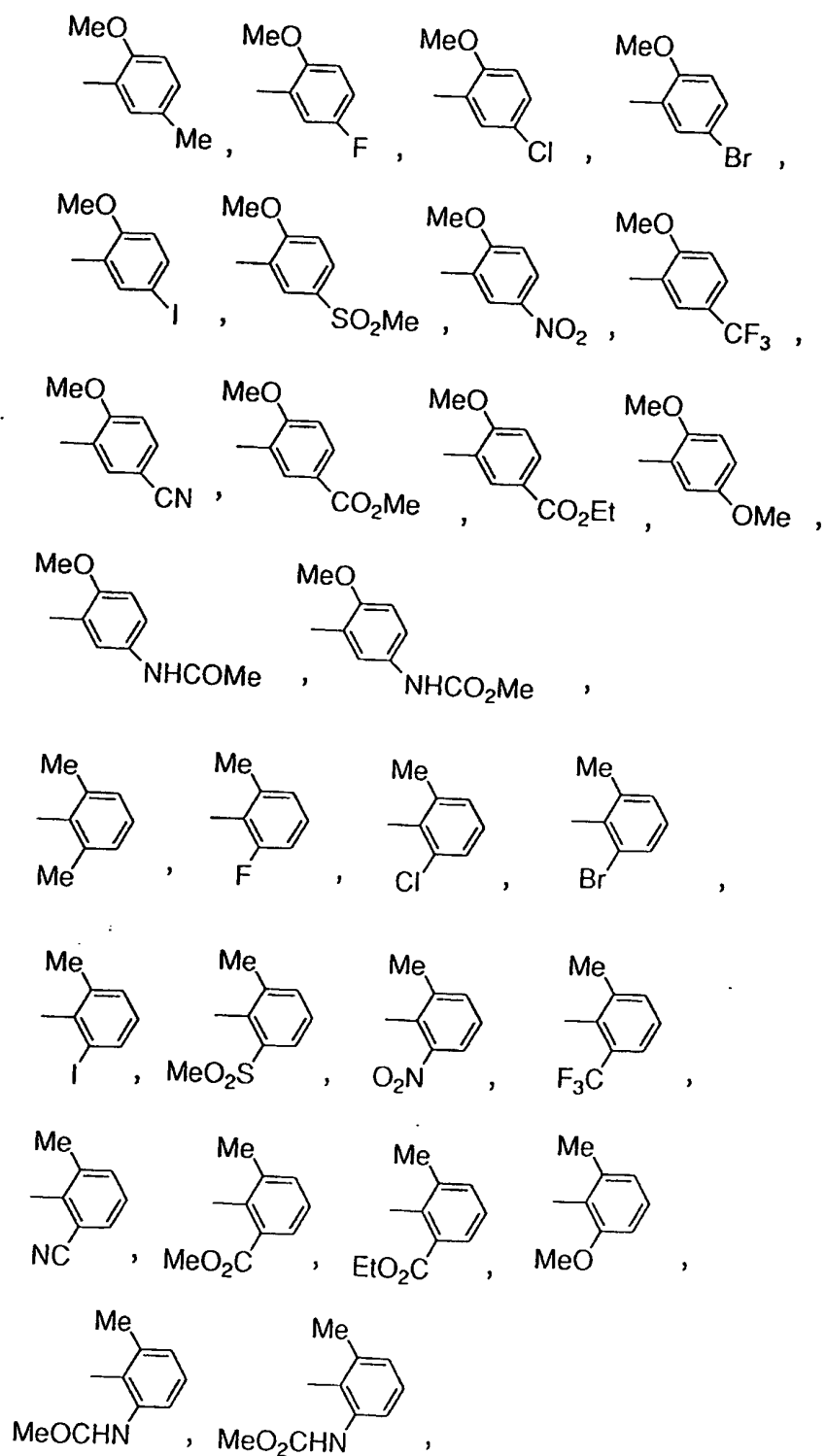


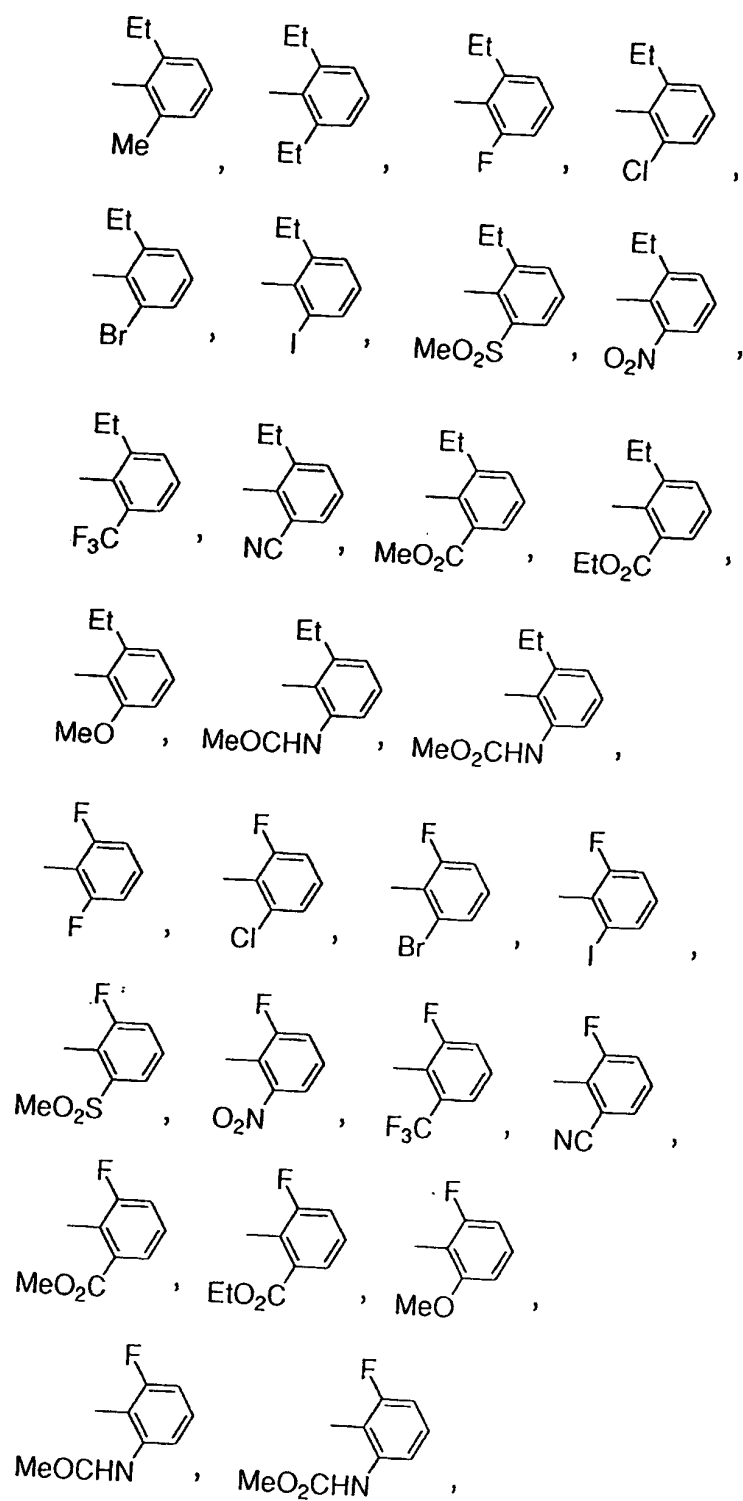


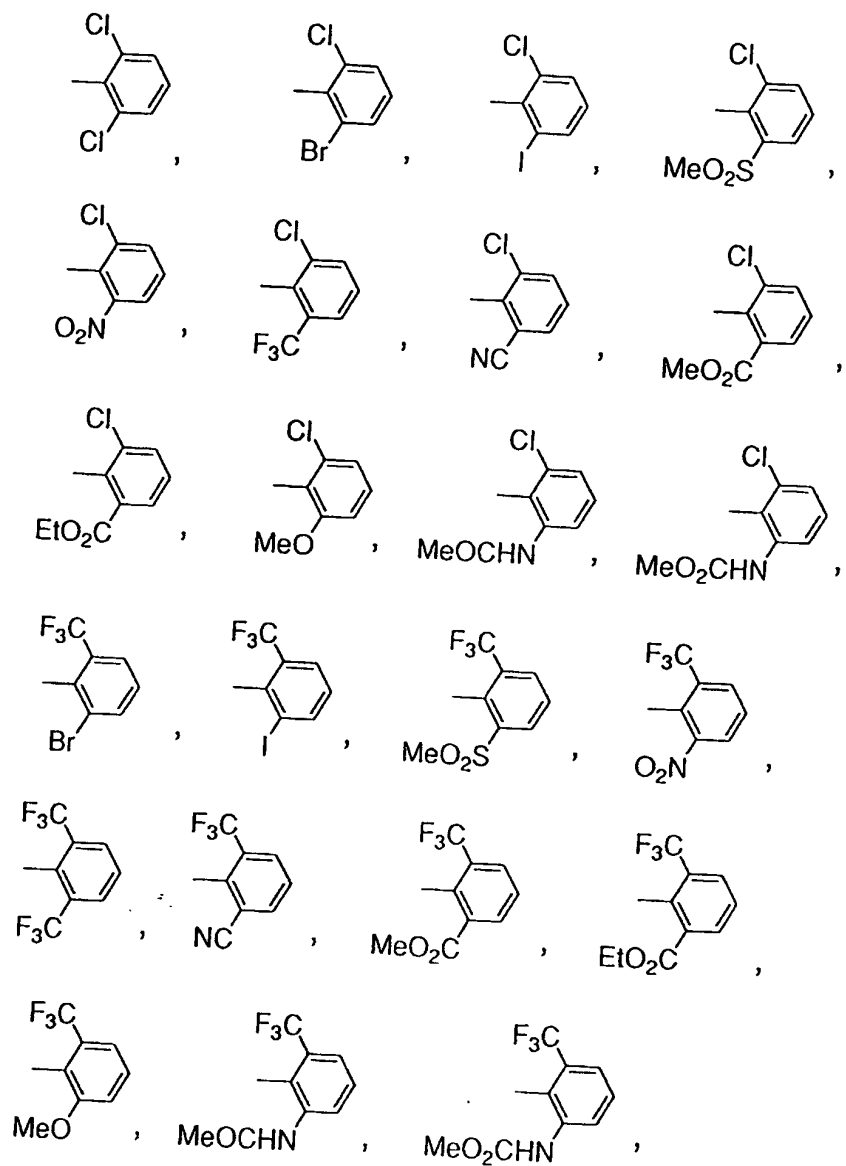


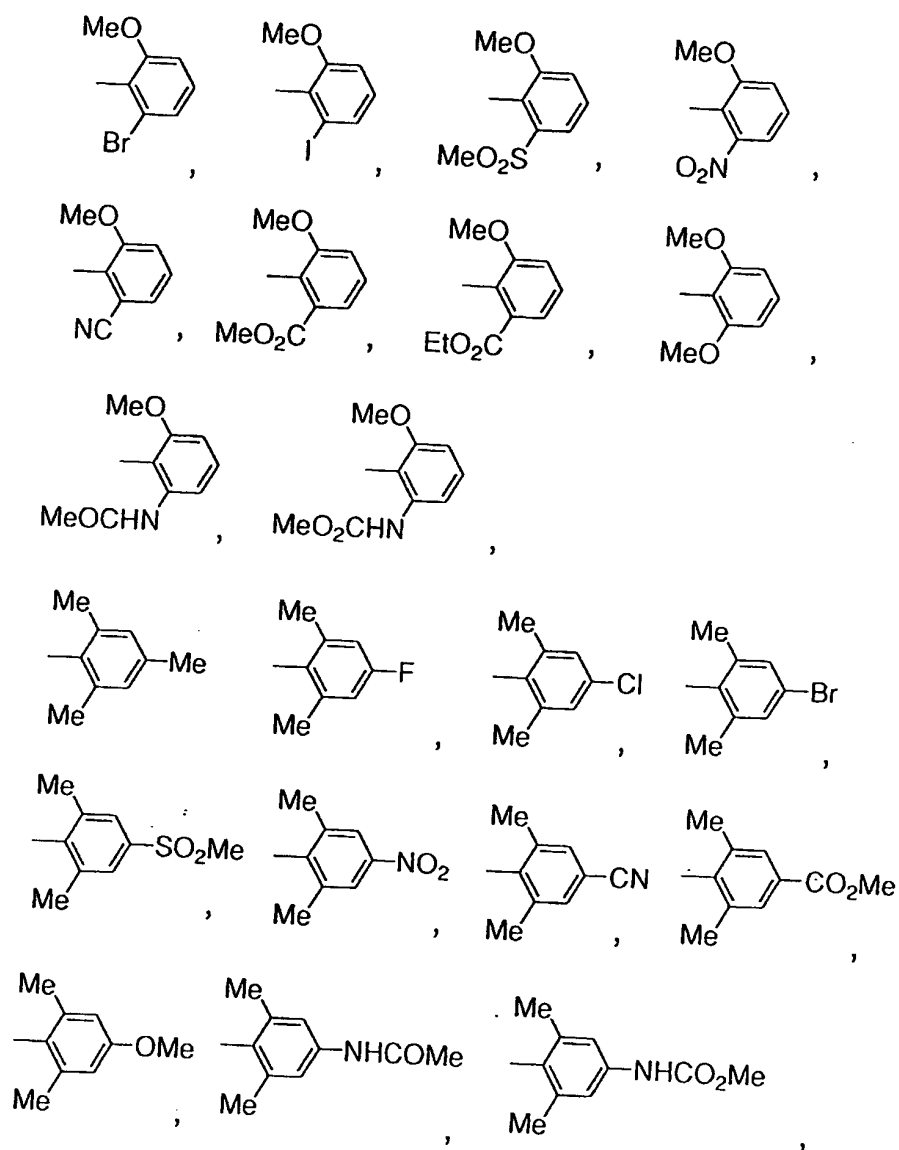


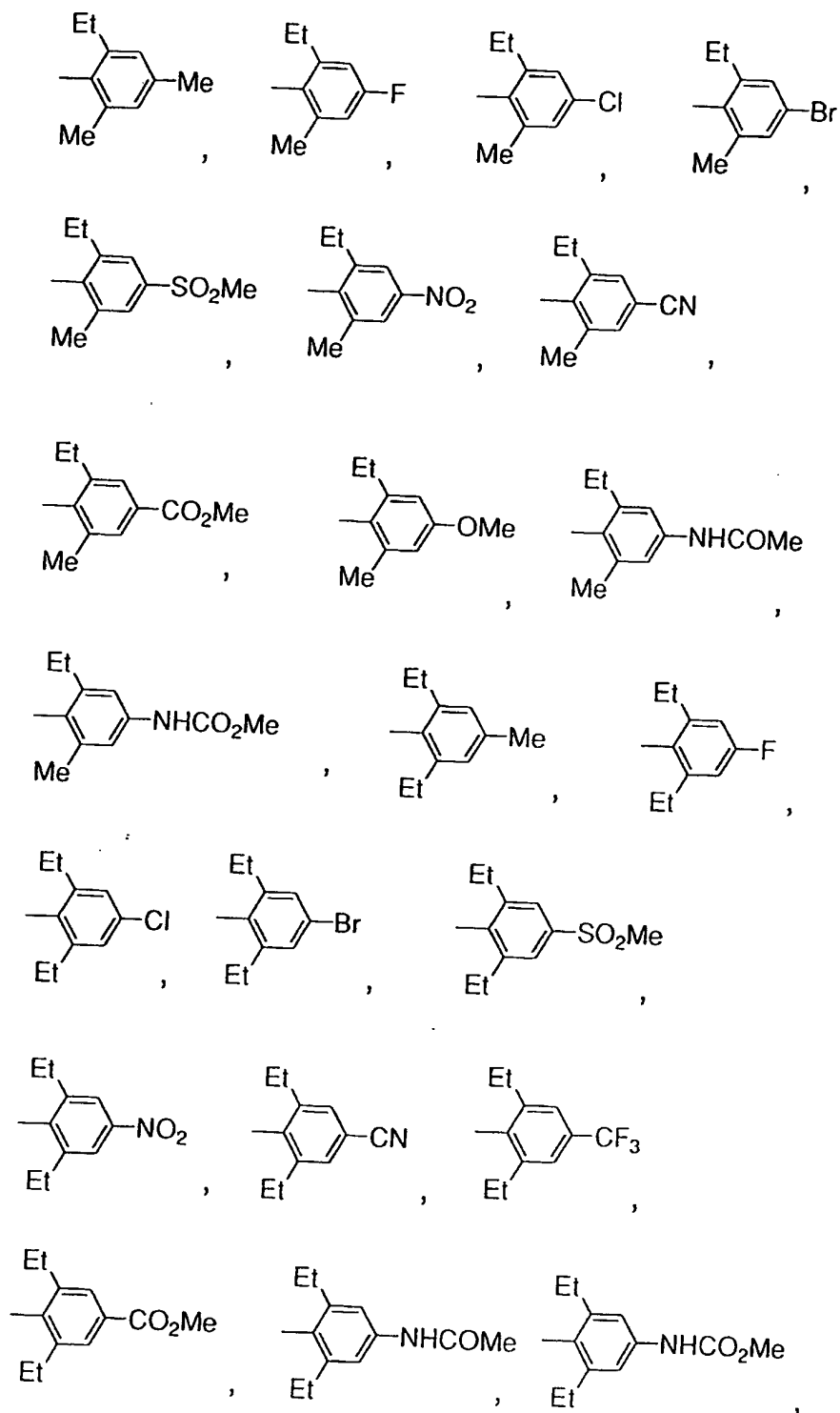


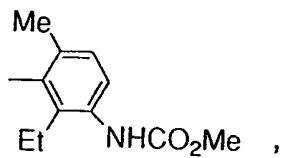
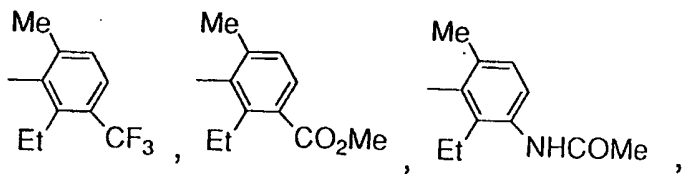
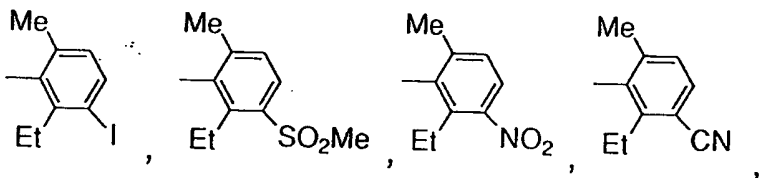
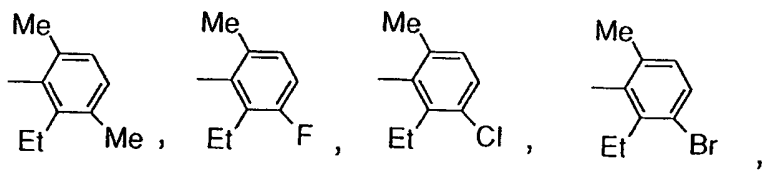
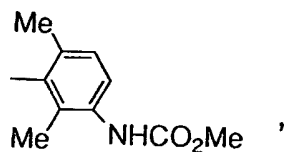
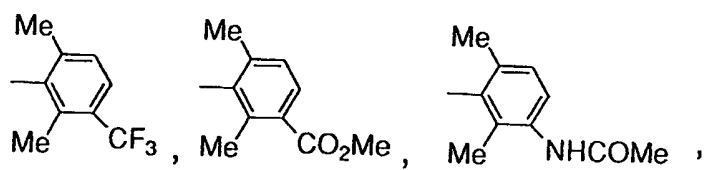
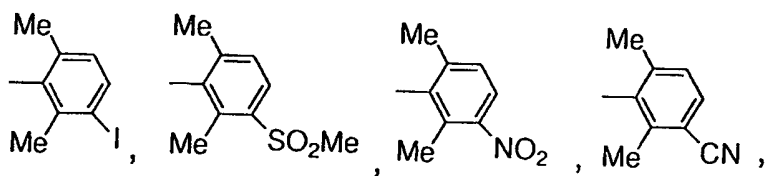
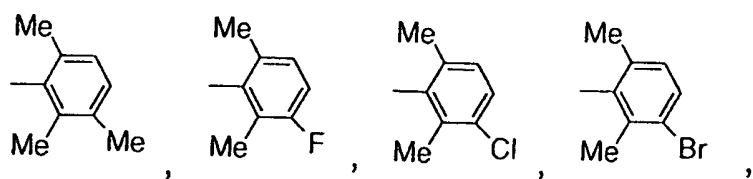


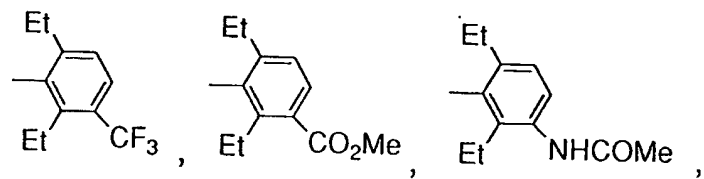
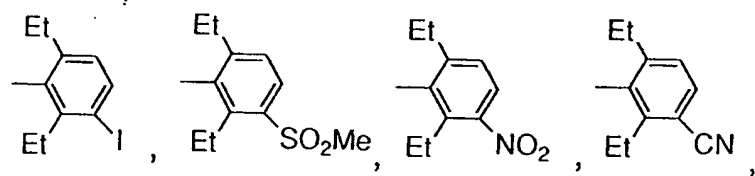
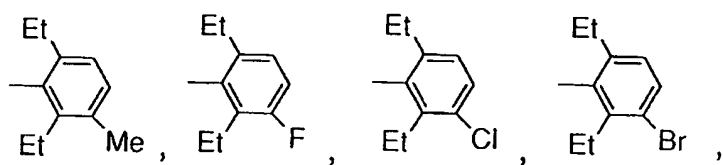
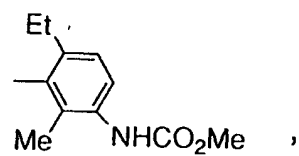
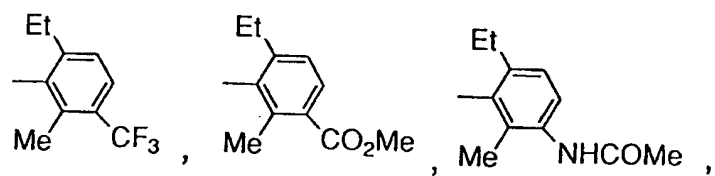
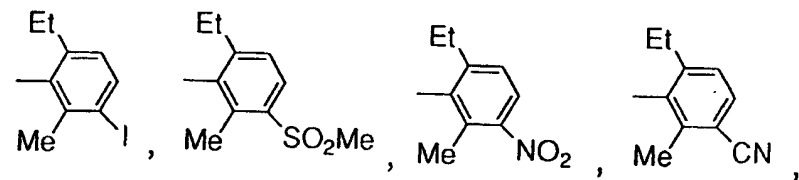
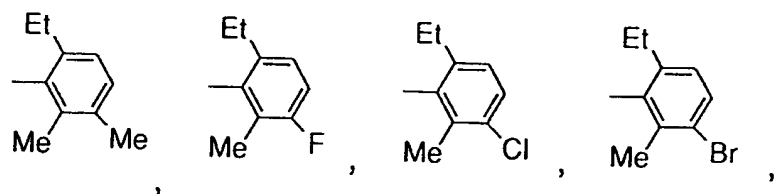


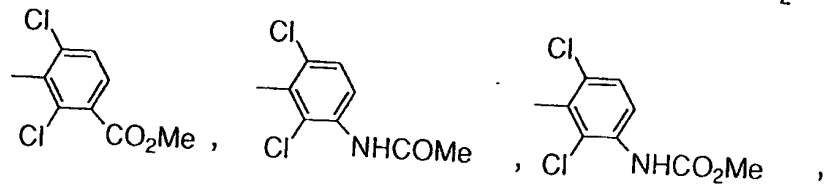
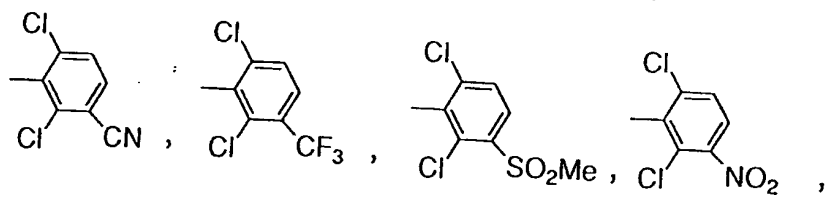
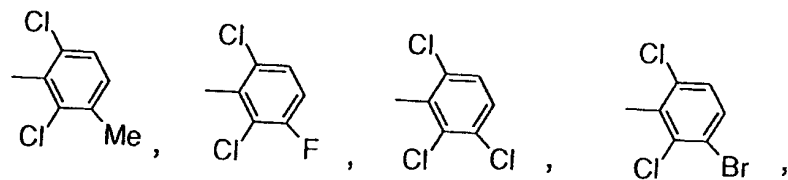
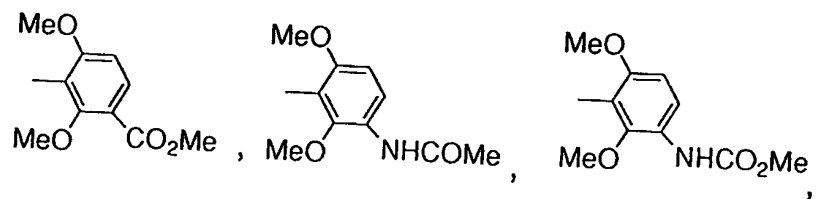
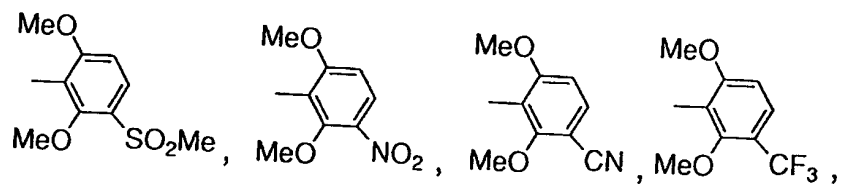
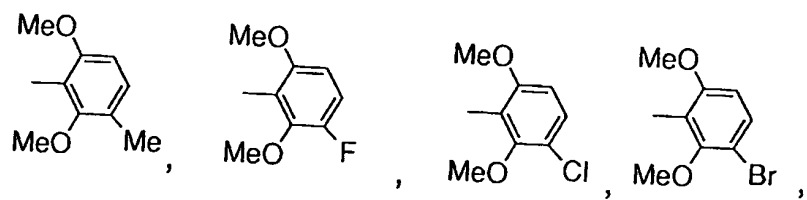


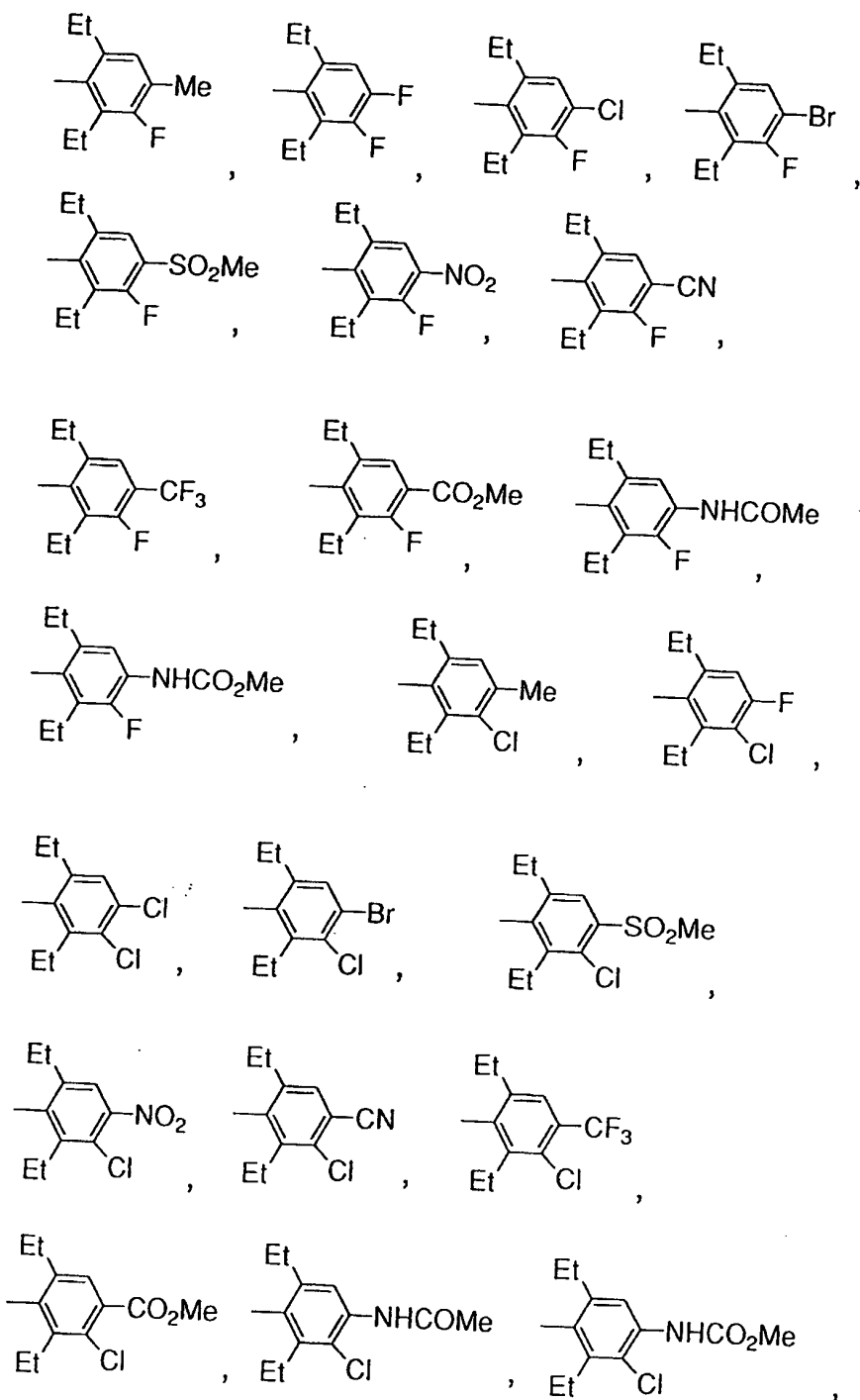


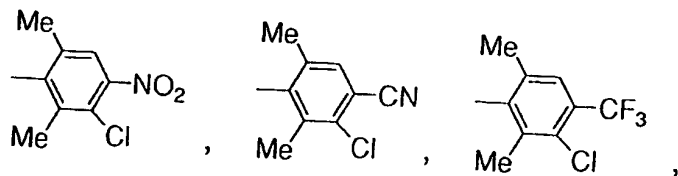
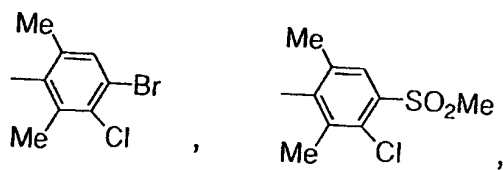
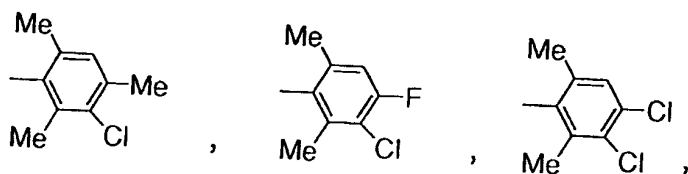
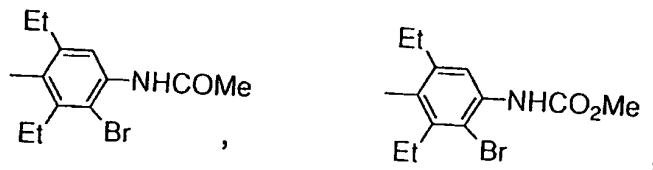
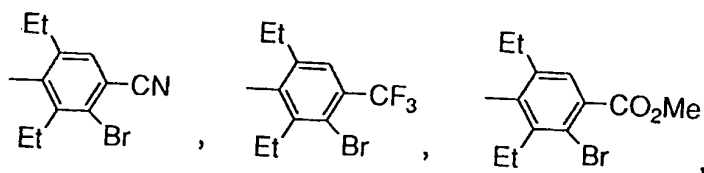
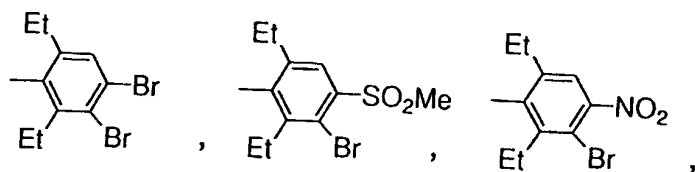
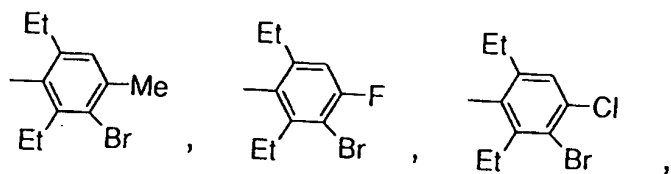


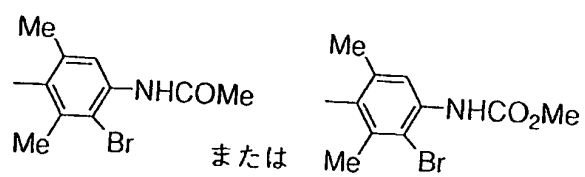
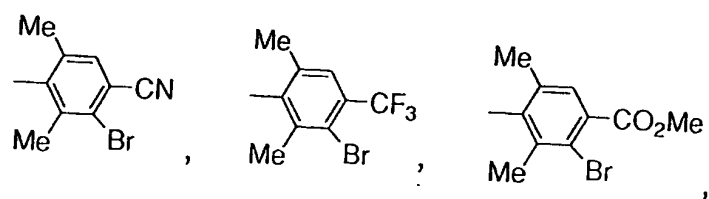
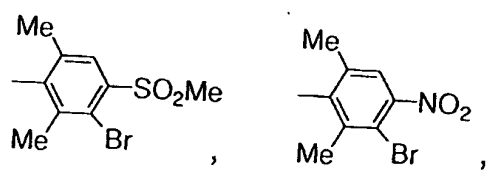
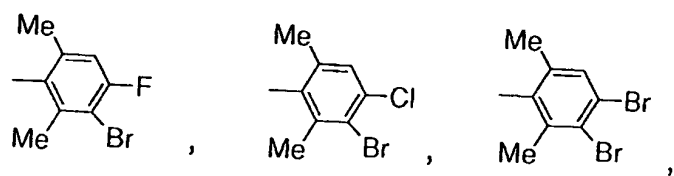
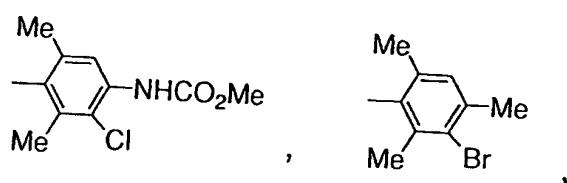
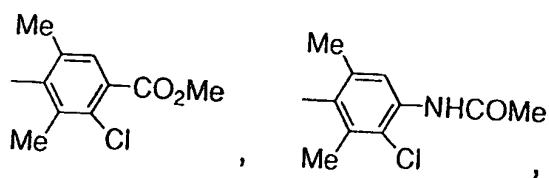












またR⁴の置換位置としては、アニライド結合に対して2, 6-位、2, 3-位、2, 5-位、2, 3, 6-位、2, 3, 5-位、2, 4, 6-位または2, 3, 4, 6-位が挙げられ、好ましくは2, 6位、2, 3-位、2, 5-位、2, 3, 6-位又は2, 4, 6位が挙げられる。

R⁵及びR⁶としては、水素原子、メチル基、エチル基又はイソプロピル基が挙げられ、好ましくは水素原子又はメチル基が挙げられる。

R⁷としては、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、シクロプロピル基又はシクロペンチル基が挙げられ、好ましくはメチル基又はエチル基が挙げられる。

R⁸及びR⁹としては、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、ビニル基、アリル基、メタリル基、クロチル基、エチニル基、プロパルギル基、1-メチルプロパルギル基、3-メチルプロパルギル基、トリクロロメチル基、ジフルオロメチル基、ジフルオロクロロメチル基、トリフルオロエチル基、3-クロロアリル基、3-クロロプロパルギル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、2, 2-ジクロロシクロプロピル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、メトキシエチル基、エトキシメチル基、メチルチオメチル基、エチルチオメチル基、アセチル基、プロピオニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、ベンゾイル基、シアノ基、ベンジル基、1-フェニルエチル基、スチリル基、シンナミル基、3-フェニルプロパルギル基、メタンスルホニル基、エタンスルホニル基又はジメチルスルファモイル基が挙げられ、好ましくは水素原子、メチル基、エチル基、アリル基、プロパルギル基、アセチル基、エトキシカルボニル基又はメタンスルホニル基が挙げられる。

Lとしては、酸素原子又はイオウ原子が挙げられ、好ましくは酸素原子が挙げられる。

R¹⁰としては、水素原子、メチル基、エチル基、イソプロピル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、ジフルオロプロモメチル基、シクロプロピル基、アリル基、3-クロロアリル基、プロパルギル基、3-メチルプロパルギル基、1-メチルプロパルギル基、3-クロロプロパルギル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、メトキシエチル基、エトキシエチル基、メチルチオメチル基、

メトキシカルボニルメチル基、エトキシカルボニルメチル基、フェニル基、ベンジル基、シアノメチル基、シアノエチル基又はジメチルカルバモイルメチル基が挙げられ、好ましくは水素原子、メチル基、エチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、アリル基、プロパルギル基又はメトキシメチル基が挙げられる。

R¹¹としては、水素原子、メチル基、エチル基、トリクロロメチル基、トリフルオロメチル基、トリフルオロエチル基、シクロプロピル基、アリル基、プロパルギル基、フェニル基、ベンジル基又はエトキシカルボニルメチル基が挙げられ、好ましくは、水素原子、メチル基又はエチル基が挙げられる。

R¹²及びR¹³としては、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、i-プロピル基、ブチル基、i-ブチル基、s-ブチル基、t-ブチル基、ペンチル基、ヘキシル基、ヘプチル基、オクチル基、アリル基、メタリル基、クロチル基、3-メチルー2-ブテニル基、1-メチルー2-プロベニル基、1, 1-ジメチルプロベニル基、プロパルギル基、1-メチルプロパルギル基、1, 1-ジメチルプロパルギル基、2-ブチニル基、ホモプロパルギル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロエチル基、クロロエチル基、クロロプロピル基、ブromoプロピル基、フルオロプロピル基、2-クロロアリル基、3-クロロアリル基、3, 3-ジクロロアリル基、3-クロロプロパルギル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、2, 2-ジクロロシクロプロピルメチル基、ヒドロキシエチル基、3-ヒドロキシプロピル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、メトキシエチル基、エトキシエチル基、メチルチオメチル基、アセチル基、プロピオニル基、ピバロイル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、ベンゾイル基、4-メトキシベンゾイル基、シアノ基、フェニル基、ベンジル基、4-メトキシベンジル基、1-フェニルエチル基、2-フェニルエチル基、スチリル基、シンナミル基、2-フェニルエチニル基、3-フェニルプロパルギル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、ジメチルスルファモイル基、テトラヒドロフルフリル基又はテトラヒドロチエニル基が挙げられ、好ましくは水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロペンチル基、アリル基又はプロパルギル基が挙げら

れる。

R^{12} と R^{13} が一緒になったものとしては $-(CH_2)_4-$ 基、 $-(CH_2)_5-$ 基、 $-(CH_2)_6-$ 基、 $-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$ 基又は $-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$ 基が挙げられる。

R^{14} としては、水素原子、メチル基、エチル基、イソプロピル基、アリル基、フェニル基又はベンジル基が挙げられ、好ましくは、水素原子、イソプロピル基又はアリル基が挙げられる。

R^{15} としては、水素原子、メチル基又はエチル基が挙げられ、好ましくは水素原子が挙げられる。

R^{16} 及び R^{17} としては、水素原子、メチル基、エチル基、イソプロピル基、フェニル基、ベンジル基又はメチルチオエチル基が挙げられ、好ましくは水素原子、メチル基、エチル基又はイソプロピル基が挙げられる。

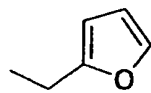
R^{16} 及び R^{17} が一緒になったものとしては、 $-(CH_2)_4-$ 基または $-(CH_2)_5-$ 基が挙げられる。

R^{18} としては、水素原子、メチル基又はエチル基が挙げられ、好ましくはメチル基又はエチル基が挙げられる。

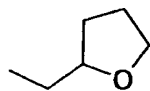
R^{19} としては水素原子、メチル基、エチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、アリル基、プロパルギル基、フェニル基又はベンジル基が挙げられ、好ましくは水素原子又はメチル基が挙げられる。

R^{20} としては、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソブチル基、アリル基、3-クロロアリル基、プロパルギル基、シアノメチル基、メトキシメチル基又はメチルチオメチル基が挙げられ、好ましくは水素原子、メチル基、エチル基又はアリル基が挙げられる。

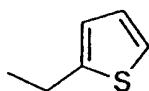
Gとしては、G (a)、G (b)、G (c) 又はG (d)



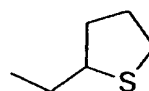
G(a)



G(b)



G(c)

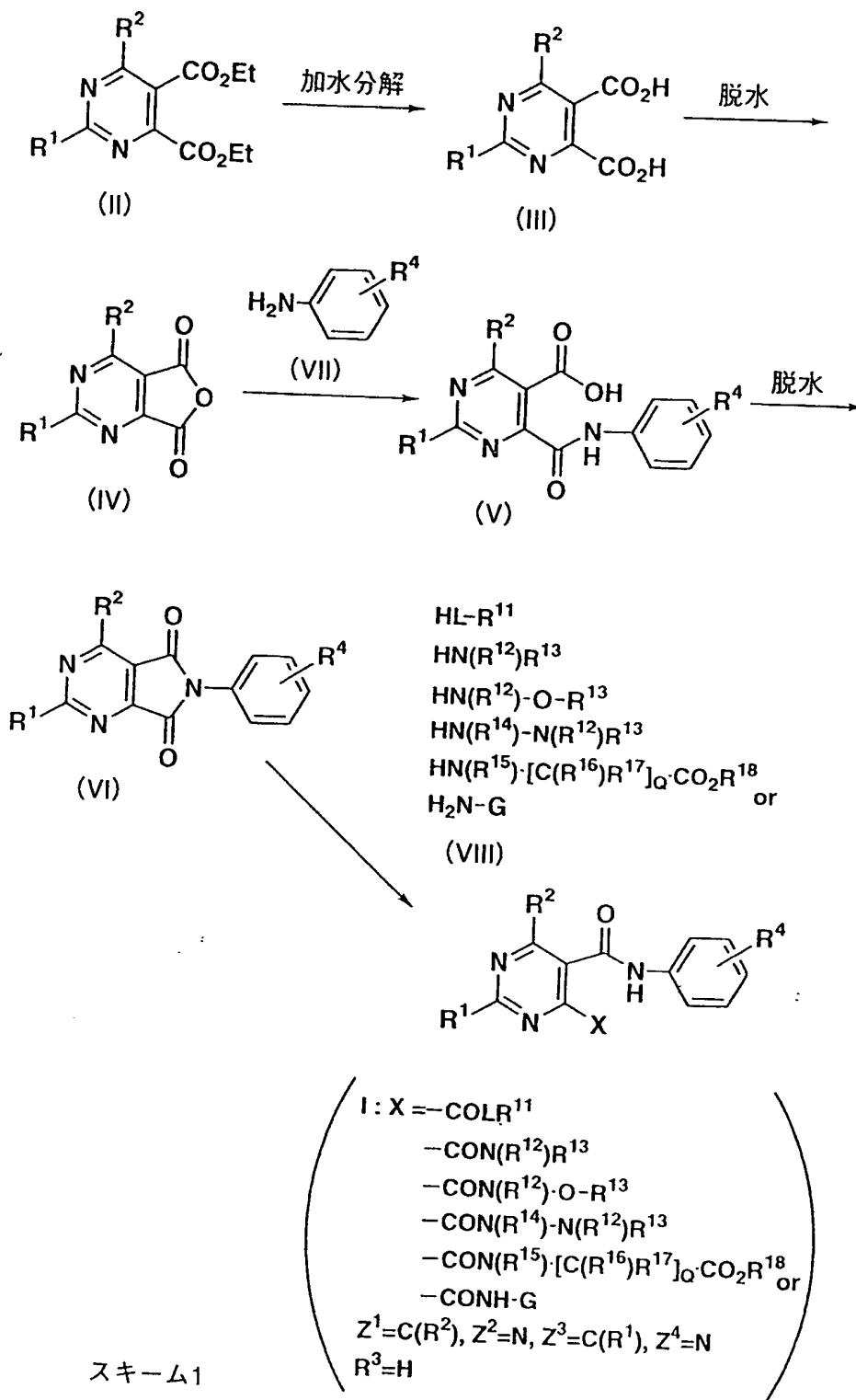


G(d)

のいずれかの基が挙げられる。

R²¹としては水素原子、メチル基、エチル基、シクロプロピル基又はターシャリーブチル基が挙げられる。

本発明化合物は、たとえばスキーム1～9に示す方法によって合成することが出来る。スキーム1～9のR¹, R², R³, R⁴, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R²², R²³, G、Lはそれぞれ前記と同様の意味を表わし、またL eはハロゲン基を表わし、Qは0, 1, 2、または3を表わす。



(スキーム 1)

ピリミジン-4, 5-ジカルボン酸ジエステル (II) を加水分解し、ジカルボン酸 (III) とした後、再び脱水してジカルボン酸無水物 (IV) とする。次いでアニリン化合物 (VII) と反応させてアニライド化合物 (V) とし、再び脱水閉環して N-フェニルイミド体 (VI) とする。最後に各種の求核試剤 (VIII) と反応させて、本発明化合物 (I : X が CO-L-R^{11} 、 $\text{CON(R}^{12})\text{R}^{13}$ 、 $\text{CON(R}^{12})\text{-O-R}^{13}$ 、 $\text{CON(R}^{14})\text{-N(R}^{12})\text{R}^{13}$ 、 $\text{-CON(R}^{15})\text{-[C(R}^{16})\text{R}^{17}]_q\text{-CO}_2\text{R}^{18}$ 又は -CONH-G 、 $\text{Z}^1=\text{C(R}^2\text{)}$ 、 $\text{Z}^2=\text{N}$ 、 $\text{Z}^3=\text{C(R}^1\text{)}$ 、 $\text{Z}^4=\text{N}$ 、 $\text{R}^3=\text{H}$ の場合) へ導くことが出来る。

化合物 (II) から化合物 (III) への加水分解反応で使用出来る溶媒としては例えばメタノール、エタノールなどのアルコール類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素などのハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類、アセトニトリル、N, N-ジメチルホルムアミド等の極性非プロトン溶媒類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類、酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸類、アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン類が挙げられ、好ましくはメタノール、エタノールなどのアルコール類が挙げられる。これらの溶媒は単独あるいは混合して使用することも出来る。

加水分解の触媒としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類、塩酸、硫酸等の鉱酸類が挙げられ、好ましくは水酸化ナトリウム、水酸化カリウムを使用することが出来る。これらの触媒の使用量は、化合物 (II) に対して 0.1 ~ 等モルないし過剰モルを使用するのが良く、好ましくは 2 ~ 2.5 倍モル使用するのが良い。

反応温度は -10°C から不活性溶媒の沸点域から選択すれば良く、好ましくは室温 ~ 120°C で行うのが良い。反応時間は反応温度、反応規模等により一定しないが、数分ないし 48 時間の範囲で行えば良く、好ましくは 30 分から 5 時間で行うのが良い。また目的物は必要に応じて抽出、再結晶、蒸留等の単離手段により精製出来るが、特に精製を行わず、そのまま次の反応に供することも出来

る。

化合物 (II) のピリミジン-4, 5-ジカルボン酸ジエステルは、例えば J. Chem. Soc., Perkin Transl, 1980, 1667-1670; J. Heterocycl. Chem., 14, 695-696 (1977) J. Heterocycl. Chem., 2, 202-204 (1965) 又は Tetrahedron Letters, 39, 3853 (1998) 等を参考にして合成することが出来る。

化合物 (III) から化合物 (IV) への脱水閉環反応で使用出来る溶媒としては、反応の進行を阻害しないものが良く、例えばジクロロメタン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、N, N-ジメチルホルムアミド等の非プロトン性極性溶媒類、酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酢酸を使用することが出来る。また以下に例示する脱水剤をそのまま溶媒として用いてもよい。

脱水剤としては例えば無水酢酸、トリフルオロ酢酸無水物、塩化チオニル、オキシ塩化リン、ジシクロヘキシルカルボジイミド等の脱水剤を使用することが出来る、その使用量は化合物 (III) に対して等モルないし過剰モル使用することが出来る、また溶媒として用いてもよい。反応温度は室温ないしは溶媒の沸点域から選択すれば良く、反応時間は反応温度、反応規模により一定しないが、数分ないし48時間の範囲で行えば良い。好ましくは30分から5時間の範囲が良い。

反応終了後、目的物を単離し、必要に応じて再結晶、蒸留、カラムクロマトグラフィー等の精製手段により目的化合物を精製出来るが、目的物を単離せず、そのまま次の反応に供してもよい。

化合物 (IV) から化合物 (V) のアニライド化合物への合成反応で使用出来る溶媒としては、例えば化合物 (II) から化合物 (III) への合成反応で例示した。溶媒の他に必要に応じてピリジンも使用することが出来る。

反応は化合物 (IV) に対し化合物 (VII) のアニリン化合物を等モルないし過剰モル使用することが出来る。好ましくは等モルないし2倍モルの範囲である。またアニリン化合物の塩を用いてもよい。使用出来る塩基としては、例えば化合物 (II) から化合物 (III) への合成反応で例示した無機塩基類の他に、例えば水素

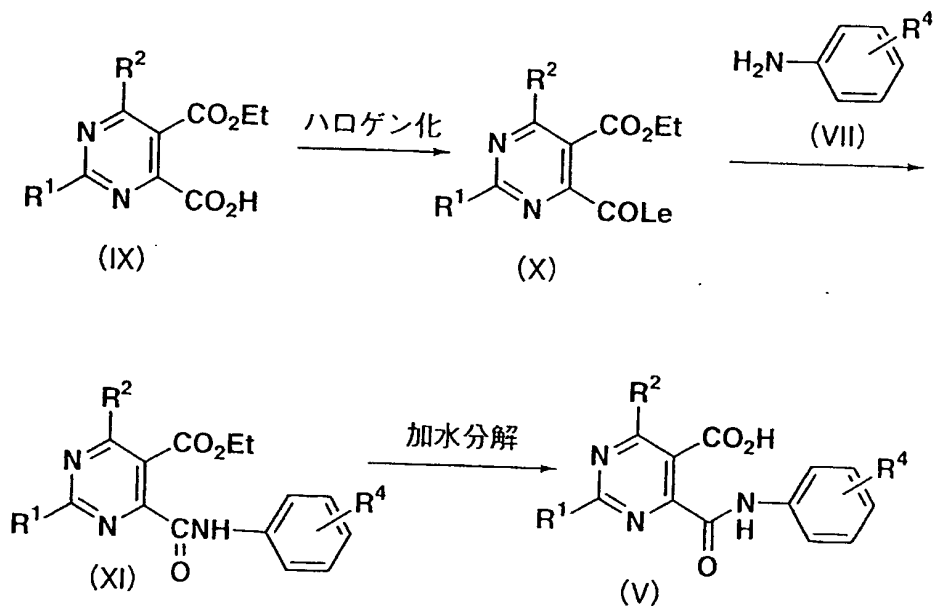
化ナトリウムなどの水素化金属類、ピリジン、トリエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5, 4, 0〕-7-ウンデセンなどの有機塩基類、ナトリウムメトキシドなどのアルコキシド類を加えて反応を行ってもよい。

反応温度は-10℃ないし不活性溶媒の沸点域から適宜選択すれば良く、好ましくは0℃ないし150℃の範囲で行えば良い。

反応終了後、目的物を単離し、必要に応じて再結晶、蒸留、カラムクロマトグラフィー等の精製手段により目的化合物を精製出来るが、目的物を単離せず、そのまま次の反応に供してもよい。

化合物(V)から化合物(VI)への脱水閉環反応は、先に化合物(III)から化合物(IV)への脱水閉環反応に関して例示した条件に準じて、同様に反応を行うことが出来る。

また化合物(VI)から化合物(I)への合成反応については、先に化合物(I V)から化合物(V)への反応に関して例示した条件に準じて行い、目的化合物である(I)へと導くことが出来る。



スキーム2

(スキーム 2)

ピリミジン-4, 5-ジカルボン酸-6-モノエステル (IX) をハロゲン化して酸ハライド (X) とし、次いでアニリン化合物 (VII) と反応させてアニライド化合物 (XI) とする。これを加水分解することにより、スキーム 1 の化合物 (V) へと導くことが出来る。

化合物 (IX) から化合物 (X) へのハロゲン化で使用出来る不活性溶媒としては、反応の進行を阻害しないものが良く、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素などのハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類、アセトニトリル、N, N-ジメチルホルムアミド等の極性非プロトン溶媒類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類、アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン類が挙げられ、好ましくはジクロロメタン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエンなどの芳香族炭化水素類が挙げられる。これらの溶媒は単独あるいは混合して使用することも出来る。さらに以下に例示するハロゲン化剤をそのまま溶媒として用いても良い。

反応温度は-10℃から不活性溶媒の沸点域から選択すれば良く、好ましくは室温~120℃で行うのが良い。反応時間は反応温度、反応規模等により一定しないが、数分ないし48時間の範囲で行えば良く、好ましくは30分から5時間で行うのが良い。また目的物は必要に応じて抽出、再結晶、蒸留等の単離手段により精製出来るが、特に精製を行わず、そのまま次の反応に供することも出来る。

用いるハロゲン化剤としては、例えば塩化チオニル、オキシ塩化リン、シュウ酸ジクロロ、3塩化リン又は5塩化リンなどが挙げられ、好ましくは塩化チオニルが挙げられる。

化合物 (IX) のピリミジン-4, 5-ジカルボン酸-6-モノエステルは、例えば J. Chem. Soc., Perkin Transl, 1980, 1667-1670; J. Heterocycl. Chem., 14, 695-696 (1977) J. Heterocycl. Chem., 2, 202-204 (1965) 又は Tetrahedron Letters, 39, 3853 (19

98)等を参考にして合成することが出来る。

化合物(X)から化合物(XI)の反応で使用出来る不活性溶媒としては、例えばスキーム2の化合物(IX)から化合物(X)への合成反応で例示した溶媒の他にピリジン類も使用することが出来る。

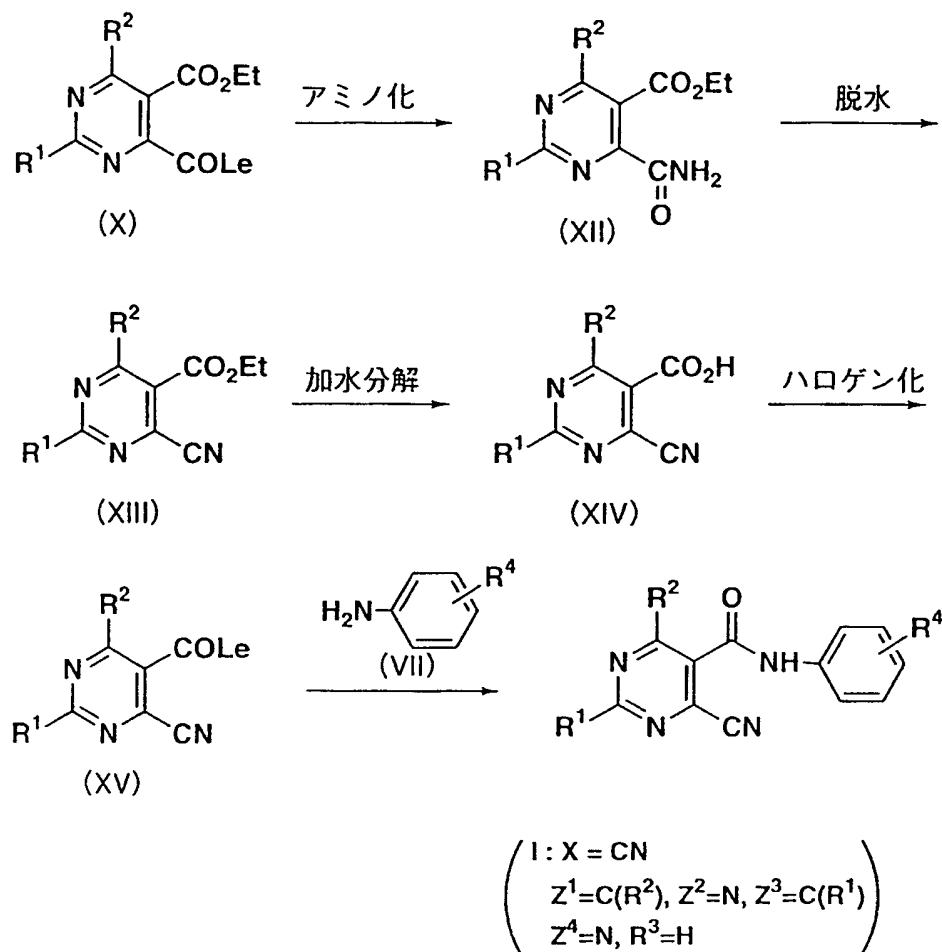
反応温度は -10°C から不活性溶媒の沸点域から選択すれば良く、好ましくは室温 $\sim 120^{\circ}\text{C}$ で行うのが良い。反応時間は反応温度、反応規模等により一定しないが、数分ないし48時間の範囲で行えば良く、好ましくは30分から5時間で行うのが良い。また目的物は必要に応じて抽出、再結晶、蒸留、カラムクロマトグラフィー等の単離手段により精製出来るが、特に精製を行わず、そのまま次の反応に供することも出来る。

反応は化合物(X)に対し、アニリン(VII)を等モルないし過剰モル使用することが出来る。好ましくは等モルないし2倍モルの範囲である。また適当な塩基を用いて反応を行っても良い。

使用出来る塩基としては、例えば化合物(II)から化合物(III)への合成反応で例示した無機塩基類の他に、例えば水素化ナトリウムなどの水素化金属類、ピリジン、トリエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]-7-ウンデセンなどの有機塩基類、ナトリウムメトキシドなどのアルコキシド類を加えて反応を行ってもよい。

反応は化合物(X)に対し、塩基を等モルないし過剰モル使用することが出来る。好ましくは等モルないし2倍モルの範囲である。

化合物(XI)から化合物(V)への加水分解反応においては、例えばスキーム1の化合物(II)から化合物(III)への加水分解で用いた条件で同様に反応を行うことが出来る。また目的物は必要に応じて抽出、再結晶、カラムクロマトグラフィー等の精製手段により精製出来る。



スキーム3

(スキーム3)

スキーム2で用いた酸ハライド(X)をアミノ化し化合物(XII)とし、次いで脱水することによりニトリル化合物(XIII)とする。これを加水分解してカルボン酸(XIV)とし、ハロゲン化、アニリンとの縮合反応により、本発明化合物(I: X=CN, Z¹=C(R²), Z²=N, Z³=C(R¹), Z⁴=N, R³=Hの場合)へ導くことが出来る。

化合物(X)から化合物(XII)へのアミノ化反応は、例えばスキーム2の化合物(X)から化合物(XI)への反応に用いた条件で、同様に反応を行うことが出

来る。反応は化合物 (X) に対してアンモニアを等モルないし過剰モル使用することが出来る。好ましくは等モルないし、3 倍モルの範囲である。また目的物は必要に応じて抽出、再結晶、蒸留、カラムクロマトグラフィー等の単離手段により精製出来るが、特に精製を行わず、そのまま次の反応に供することも出来る。

化合物 (XII) から化合物 (XIII) への脱水反応は、例えばスキーム 1 の化合物 (II) から化合物 (IV) への脱水反応に用いた条件で、同様に反応を行うことが出来る。

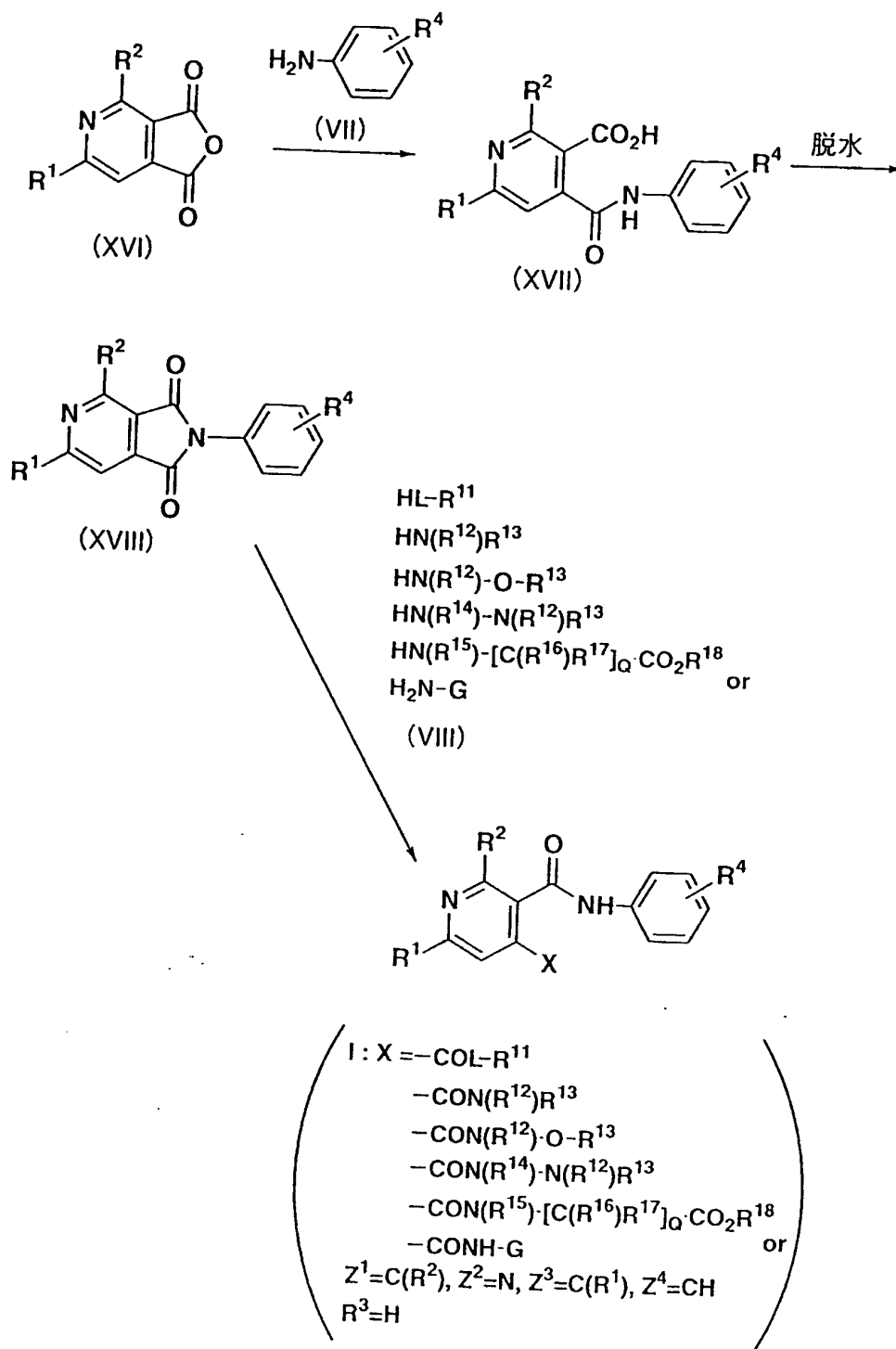
また上の反応で例示した脱水剤の他に、3 塩化リン、5 塩化リン等のハロゲン化リン類、パラトルエンスルホン酸等の有機酸類又は塩酸、硫酸等の鉱酸類を用いてもよい。その使用量は化合物 (XI) に対して等モルないし過剰モル使用することが出来る。また脱水剤をそのまま溶媒として使用することも出来る。

反応温度は -10°C から不活性溶媒の沸点域から選択すれば良く、好ましくは室温 $\sim 120^{\circ}\text{C}$ で行うのが良い。反応時間は反応温度、反応規模等により一定しないが、数分ないし 48 時間の範囲で行えば良い。

反応終了後、目的物を単離し、必要に応じて再結晶蒸留、カラムクロマトグラフィー等の精製手段により目的化合物を精製出来る。

また、化合物 (XIII) から化合物 (XIV) への加水分解反応については、例えばスキーム 1 の化合物 (II) から化合物 (III) への加水分解で用いた条件で反応を行うことが出来る。

更に、化合物 (XIV) から本発明化合物 1 への合成反応についても、例えばスキーム 2 の化合物 (IX) から化合物 (XI) への合成反応に用いた条件で、同様に反応を行うことが出来る。また目的物は必要に応じて抽出、再結晶、蒸留、カラムクロマトグラフィー等の単離手段により精製出来る。



スキーム4

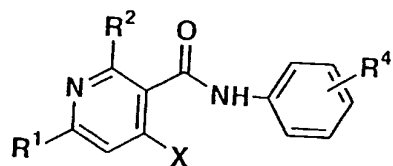
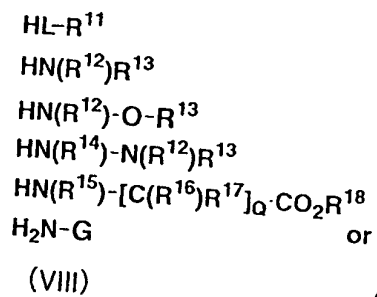
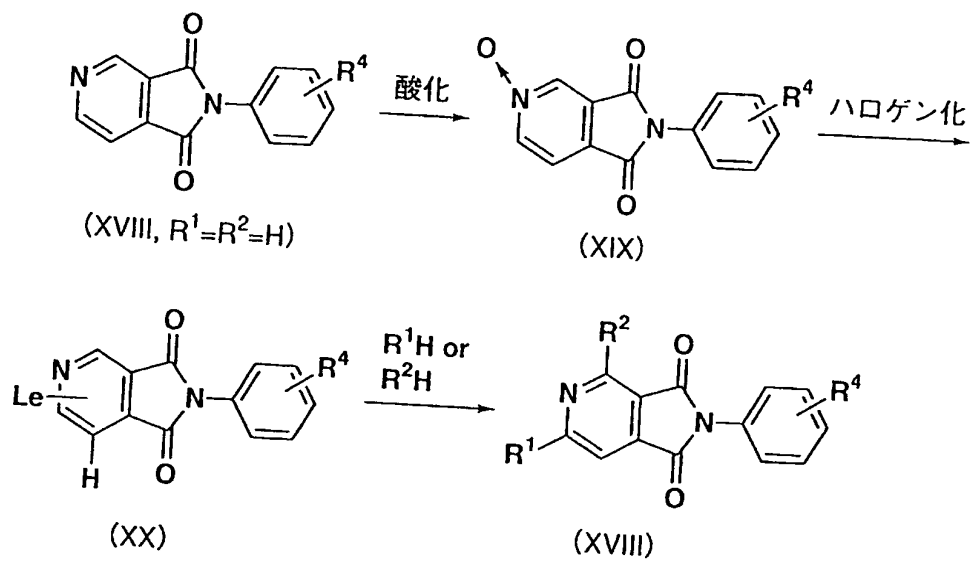
(スキーム 4)

ピリジンカルボン酸無水物 (XVI) をアニリン化合物 (VII) と反応させ、アニライド化合物 (XVII) とし、脱水閉環して N-フェニルイミド体 (XVIII) とする。次いで各種の求核試剤 (VIII) と反応させて、本発明化合物 (1 : $X = \text{COL} - \text{R}^{11}$, $\text{CON}(\text{R}^{12})\text{R}^{13}$, $\text{CON}(\text{R}^{12}) - \text{OR}^{13}$, $\text{CON}(\text{R}^{14}) - \text{N}(\text{R}^{12})\text{R}^{13}$, $(-\text{CON}(\text{R}^{15}) - [\text{C}(\text{R}^{16})\text{R}^{17}]_q - \text{O}_2\text{R}^{18})$ 又は $-\text{CONH} - \text{G}$, $Z^1 = \text{C}(\text{R}^2)$, $Z^2 = \text{N}$, $Z^3 = \text{C}(\text{R}^1)$, $Z^4 = \text{CH}$, $\text{R}^3 = \text{H}$ の場合) へ導くことが出来る。

化合物 (XVI) から化合物 (XVII) のアニライド化合物への合成反応においては、例えばスキーム 1 の化合物 (IV) から化合物 (V) への合成反応で用いた条件で同様に反応を行うことが出来る。

反応終了後、目的物を単離し、必要に応じて再結晶、蒸留、カラムクロマトグラフィー等の精製手段により、目的化合物を精製出来るが、目的物を単離せず、そのままの反応に供してもよい。

また化合物 (XVII) から目的化合物 (I) への合成反応についても、スキーム 1 の化合物 (V) から目的化合物 (I) への反応に関して例示した条件に準じて、同様に反応を行うことが出来る。



スキーム5

I: X = -COL- R^{11} -CON(R^{12}) R^{13} -CON(R^{12})-O- R^{13} -CON(R^{14})-N(R^{12}) R^{13} -CON(R^{15})-[C(R^{16}) R^{17}] $_q$ ·CO $_2$ R^{18} or

-CONH-G

 $Z^1=CH, Z^2=N, Z^3=C(R^1), Z^4=CH$ or
 $Z^1=C(R^2), Z^2=N, Z^3=CH, Z^4=CH$
 $R^3=H$

(スキーム 5)

N-フェニルイミド体 (XVIII, $R^1=R^2=H$) を酸化剤と反応させてN-オキシド化合物 (XIX) とし、次いでハロゲン化剤と反応させることにより、ハロゲン化体 (XX) を得る。化合物 (XX) を各種の求核試剤と反応させることにより化合物 (XVIII) とし、引き続き求核試剤 (VIII) との反応により、本発明化合物 (1 : Xが $-COL-R^{11}$, $CON(R^{12})R^{13}$, $CON(R^{12})-OR^{13}$, $CON(R^{14})-N(R^{12})R^{13}$, $(-CON(R^{15})-[C(R^{16})R^{17}]_n-CO_2R^{18}$ 又は $-CONH-G$, $Z^1=CH$, $Z^2=N$, $Z^3=C(R^1)$, $Z^4=CH$ 又は $Z^1=C(R^2)$, $Z^2=N$, $Z^3=CH$, $Z^4=CH$ の場合) へ導くことが出来る。

化合物 (XVIII, $R^1=R^2=H$) から化合物 (XIX) への酸化反応で使用出来る溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル、N, N-ジメチルホルムアミド等の極性非プロトン溶媒類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類、酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸類、アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン類が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類、又は、酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸類が挙げられる。これらの溶媒は単独あるいは混合して使用することも出来る。使用する酸化剤としては、例えば過酢酸、m-クロロ過安息香酸等の有機過酸化物又は過酸化水素等の過酸化物を使用することが出来る。酸化剤の使用量は化合物 (XVIII, $R^1=R^2=H$) に対して等モルないし過剰モルを使用するのが良く、好ましくは等モルから 1.5 倍モル使用するのが良い。

また必要に応じて、酸や塩基を加えて反応を行うことが出来る。使用する酸としては、例えば塩酸、硫酸などの鉱酸類、酢酸、トリフルオロ酢酸などの有機酸類が挙げられる。また塩基としては例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム又は炭酸水素カリウム等の無機塩基類が挙げられる。

反応温度は $-10^{\circ}C$ から不活性溶媒の沸点までの間から選択すれば良く、好ましくは $0^{\circ}C$ から室温で行うのがよい。

反応時間は反応温度、反応規模等により一定しないが、数分ないし 48 時間の

範囲で行えば良く、好ましくは30分から5時間で行うのが良い。また目的物は必要に応じて抽出、再結晶、蒸留、カラムクロマトグラフィー等の単離手段により精製出来るが、特に精製を行わず、そのまま次の反応に供することも出来る。

化合物(XIX)から化合物(XX)へのハロゲン化において使用出来る溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素などのハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類、アセトニトリル、N, N-ジメチルホルムアミド等の極性非プロトン溶媒類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類、アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン類が挙げられ、好ましくはジクロロメタン、クロロホルムが挙げられる。これらの溶媒は単独あるいは混合して使用することも出来る。また、無溶媒で反応を行ってもよい。

使用するハロゲン化剤としては、例えば塩化スルフリル、三塩化リン、オキシ塩化リン又は五塩化リンが挙げられ、好ましくはオキシ塩化リンが挙げられる。

反応温度は-10℃から不活性溶媒の沸点域から選択すれば良く、好ましくは室温~120℃で行うのが良い。反応時間は反応温度、反応規模等により一定しないが、数分ないし48時間の範囲で行えば良く、好ましくは30分から5時間で行うのが良い。また目的物は必要に応じて抽出、再結晶、蒸留等の単離手段により精製出来るが、特に精製を行わず、そのまま次の反応に供することも出来る。

化合物(XX)から化合物(XVIII)への求核試剤との反応で使用出来る溶媒としては、例えばメタノール、エタノール等のアルコール類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル、N, N-ジメチルホルムアミド等の極性非プロトン溶媒類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類、酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸類、アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン類が挙げられ、好ましくはN, N-ジメチルホルムアミドが挙げられる。これらの溶媒は単独あるいは混合して使用することも出来る。

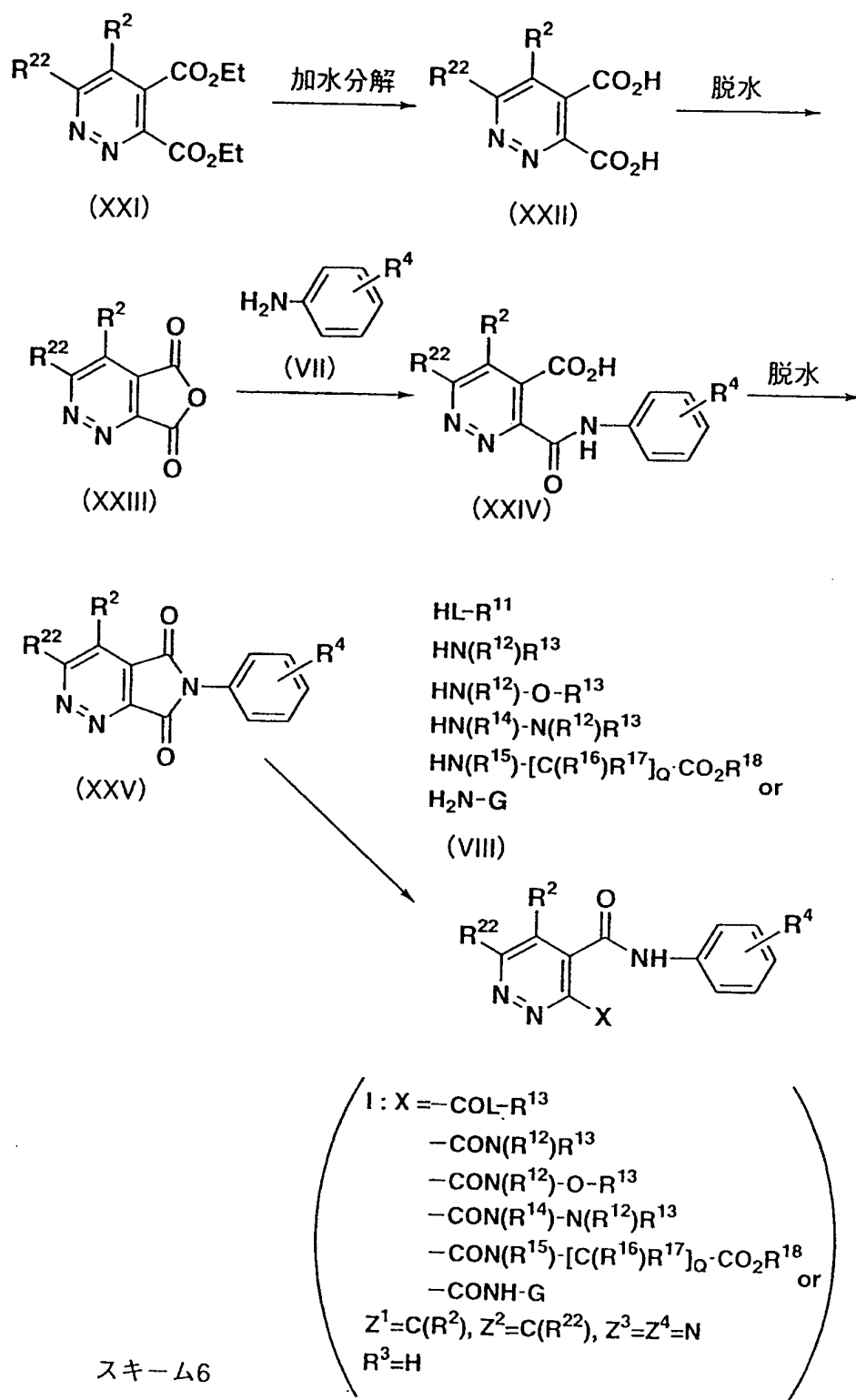
反応は化合物(XX)に対し求核試剤を等モルないし過剰モル使用することが出来る。好ましくは等モルないし2倍モルの範囲である。使用出来る塩基としては、

例えばスキーム 1 の化合物 (II) から化合物 (III) への合成反応で例示した無機塩基類の他に、例えば水素化ナトリウムなどの水素化金属類、ピリジン、トリエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ [5, 4, 0] -7-ウンデセンなどの有機塩基類、ナトリウムメトキシドなどのアルコキシド類を加えて反応を行ってもよい。

反応温度は -10℃ないし不活性溶媒の沸点域から適宜選択すれば良く、好ましくは 0℃ないし 150℃の範囲で行えば良い。

反応終了後、目的物を単離し、必要に応じて再結晶、蒸留、カラムクロマトグラフィー等の精製手段により目的化合物を精製出来るが、目的物を単離せず、そのままの反応に供してもよい。

また化合物 (XVIII) から化合物 (I) への合成反応については、スキーム 1 の化合物 (IV) から化合物 (V) への反応に関して例示した条件に準じて行い、目的化合物である (I) へと導くことが出来る。



(スキーム 6)

ピリダジン-3, 4-ジカルボン酸ジエステル(XXI)を加水分解し、ジカルボン酸(XXII)とした後、ジカルボン酸無水物(XXIII)とする。次いでアニリン化合物(VI I)と反応させてアニライド化合物(XXIV)とし、再び脱水開環させてN-フェニルイミド体(XXV)とする。最後に各種の求核試剤(VIII)と反応させて、本発明化合物($I: X = \text{COL} - R^{11}, \text{CON}(R^{12})R^{13}, \text{CON}(R^{21}) - O - R^{13}, \text{CON}(R^{14}) - N(R^{12})R^{13}, -\text{CON}(R^{15}) - [C(R^{16})R^{17}]_q - \text{CO}^2R^{18}$ 又は $-\text{CONH} - G, Z^1 = C(R^2), Z^2 = C(R^{22}), Z^3 = N, Z^4 = N$ の場合)へ導くことが出来る。

化合物(XXI)から化合物(XXII)への加水分解反応で使用出来る溶媒としては例えばメタノール、エタノールなどのアルコール類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素などのハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類、アセトニトリル、N, N-ジメチルホルムアミド等の極性非プロトン溶媒類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類、アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン類が挙げられ、好ましくはメタノール、エタノールなどのアルコール類が挙げられる。これらの溶媒は単独あるいは混合して使用することも出来る。

加水分解の触媒としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類、塩酸、硫酸等の鉱酸類が挙げられ、好ましくは水酸化ナトリウム、水酸化カリウムを使用することが出来る。これらの触媒の使用量は、化合物(XXI)に対して0.1~等モルないし過剰モルを使用するのが良く、好ましくは2~2.5倍モル使用するのが良い。

反応温度は-10℃から不活性溶媒の沸点域から選択すれば良く、好ましくは室温~120℃で行うのが良い。反応時間は反応温度、反応規模等により一定しないが、数分ないし48時間の範囲で行えば良く、好ましくは30分から5時間で行うのが良い。また目的物は必要に応じて抽出、再結晶、蒸留等の単離手段により精製出来るが、特に精製を行わず、そのまま次の反応に供することも出来る。

化合物(XXI)は、たとえば J. Heterocyclic Chem.、27, 579 (1990)などを参考にして合成することが出来る。

化合物(XXII)から化合物(XXIII)への脱水閉環反応で使用出来る溶媒としては、たとえばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素などのハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類、アセトニトリル、N, N-ジメチルホルムアミド等の極性非プロトン溶媒類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類、アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン類が挙げられ、好ましくはジクロロメタン、クロロホルム、ベンゼン、トルエン又はキシレンが挙げられる。

脱水剤としては、たとえば無水酢酸、トリフルオロ酢酸無水物、塩化チオニル、オキシ塩化リン、5塩化リン、ジシクロヘキシルカルボジイミドなどが挙げられ、好ましくは塩化チオニルが挙げられる。

これらの試薬の使用量としては、化合物(XXII)に対して等モルないし過剰モルが好ましく、等モルないし2.5当量がさらに好ましい。また、それ自体を溶媒として用いてもよい。

反応温度は-10℃から不活性溶媒の沸点域から選択すれば良く、好ましくは室温~120℃で行うのが良い。反応時間は反応温度、反応規模等により一定しないが、数分ないし48時間の範囲で行えば良く、好ましくは30分から5時間で行うのが良い。また目的物は必要に応じて抽出、再結晶、蒸留等の単離手段により精製出来るが、特に精製を行わず、そのまま次の反応に供することも出来る。

化合物(XXIII)から化合物(XXIV)への反応で使用出来る溶媒としては、たとえばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素などのハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類、アセトニトリル、N, N-ジメチルホルムアミド等の極性非プロトン溶媒類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類、酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸類、アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン類が挙げられ、好ましくはジクロロメタン、クロロホルム、ベンゼン、トルエン又はキシレンが挙げられる。

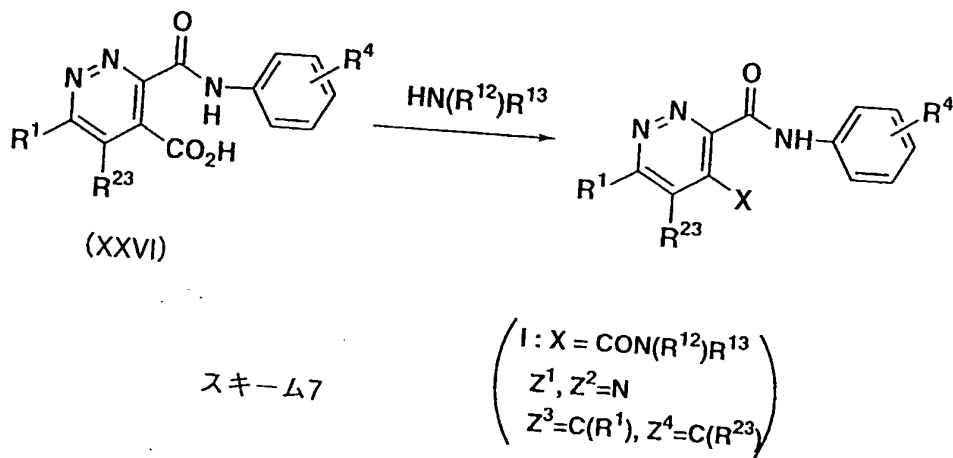
反応は化合物(XXIII)に対し、化合物(VII)のアニリン化合物を好ましくは等モ

ルないし過剰モル、より好ましくは等モルないし2当量を使用して行うことが出来る。

反応温度は -10°C から不活性溶媒の沸点域から選択すれば良く、好ましくは室温 $\sim 120^{\circ}\text{C}$ で行うのが良い。反応時間は反応温度、反応規模等により一定しないが、数分ないし48時間の範囲で行えば良く、好ましくは30分から5時間で行うのが良い。また目的物は必要に応じて抽出、再結晶、蒸留等の単離手段により精製出来るが、特に精製を行わず、そのまま次の反応に供することも出来る。

化合物(XXIV)から化合物(I)への合成反応においては、たとえばスキーム1の化合物(V)から化合物(I)への合成反応で用いた条件で同様に反応を行うことが出来る。

反応終了後、目的物を単離し、必要に応じて再結晶、蒸留、カラムクロマトグラフィー等の精製手段により、目的化合物を精製することが出来る。



(スキーム7)

スキーム6に従って合成したアニライド化合物(XXVI)と各種のアミンと脱水縮合させることにより、本発明化合物(I: $\text{X} = \text{CON}(\text{R}^{12})\text{R}^{13}$, $\text{Z}^1, \text{Z}^2 = \text{N}$, $\text{Z}^3 = \text{C}(\text{R}^1)$, $\text{Z}^4 = \text{C}(\text{R}^{23})$ の場合)へ導くことが出来る。

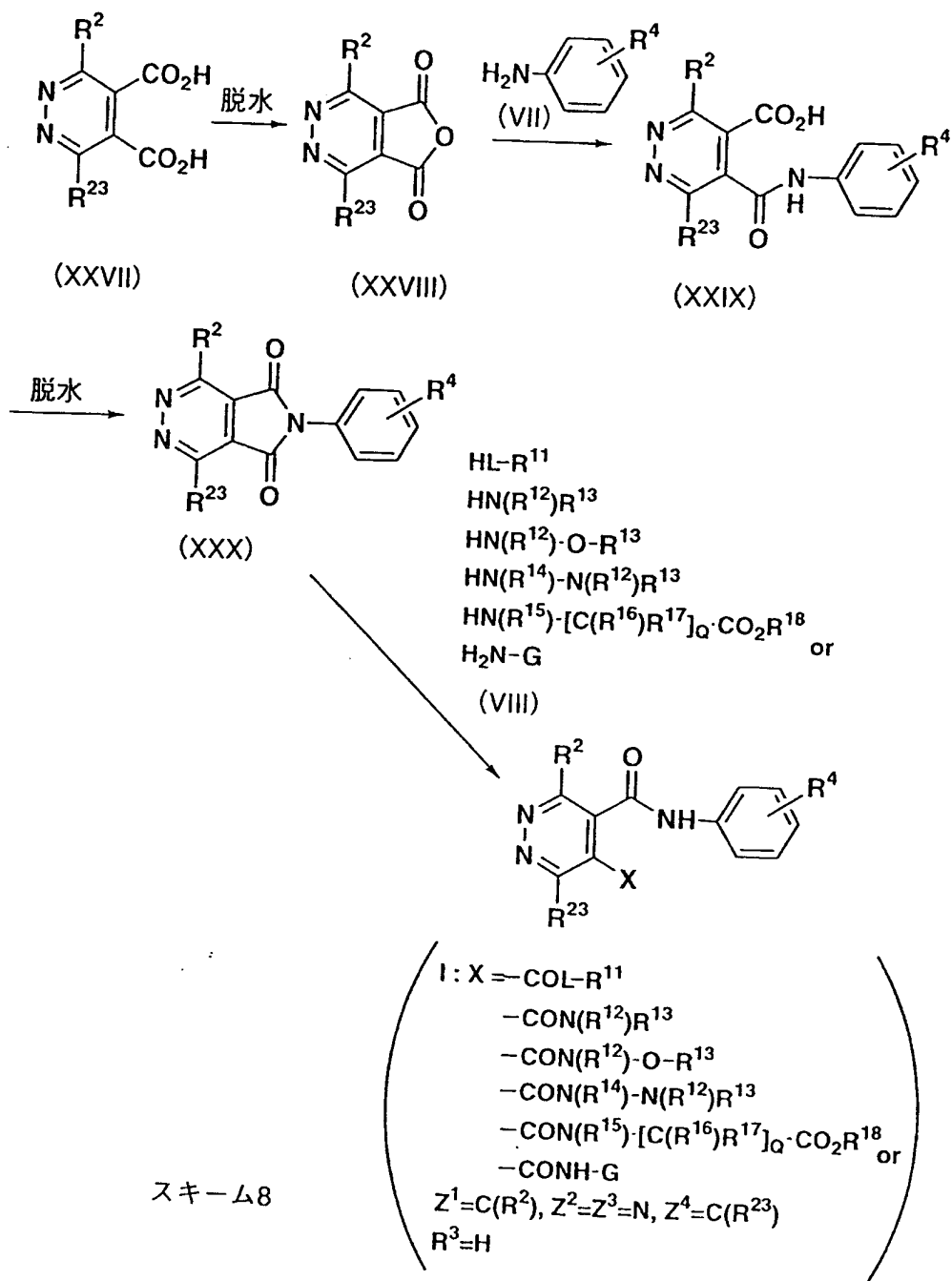
化合物(XXVI)から化合物(I)への反応で使用出来る溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素などのハロゲン化炭化水素類、ベン

ゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類、アトセニトリル、N, N-ジメチルホルムアミド等の極性非プロトン溶媒類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類、酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸類、アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン類が挙げられ、好ましくはジクロロメタン、クロロホルム、ベンゼン、トルエン又はキシレンが挙げられる。

脱水剤としては、例えば無水酢酸、トリフルオロ酢酸無水物、塩化チオニル、オキシ塩化リン、5 塩化リン、ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミドなどが挙げられ、好ましくは1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミドが挙げられる。

これらの試薬の使用量としては、化合物 (XXVI) に対して過剰モルが好ましく、等モルないし2当量がさらに好ましい。

反応温度は-10℃から不活性溶媒の沸点域から選択すれば良く、好ましくは室温~120℃で行うのが良い。反応時間は反応温度、反応規模等により一定しないが、数分ないし48時間の範囲で行えば良く、好ましくは30分から5時間で行うのが良い。また目的物は必要に応じて抽出、再結晶、蒸留、カラムクロマトグラフィー等の単離手段により精製出来る。



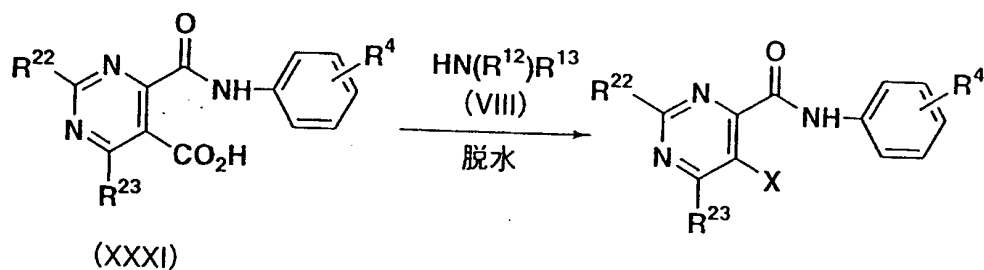
(スキーム 8)

ピリダジン-3, 4-ジカルボン酸 (XXVII) を脱水してジカルボン酸無水物 (XXVIII) とする。次いでアニリン化合物 (VII) と反応させてアニライド化合物 (XXIX) とし、再び脱水閉環してN-フェニルイミド体 (XXX) とする。最後に各種の求核試剤 (VIII) と反応させて、本発明化合物 (I : Xが $-\text{CO}-\text{L}-\text{R}^{11}$, $-\text{CON}(\text{R}^{12})\text{R}^{13}$, $-\text{CON}(\text{R}^{12})-\text{O}-\text{R}^{13}$, $-\text{CON}(\text{R}^{14})-\text{N}(\text{R}^{12})\text{R}^{13}$, $-\text{CON}(\text{R}^{15})-[\text{C}(\text{R}^{16})\text{R}^{17}]_q-\text{CO}_2\text{R}^{18}$ 又は $-\text{CONH}-\text{G}$, $\text{Z}^1=\text{C}(\text{R}^2)$, $\text{Z}^2=\text{Z}^3=\text{N}$, $\text{Z}^4=\text{C}(\text{R}^{23})$, $\text{R}^3=\text{H}$ の場合) へ導くことが出来る。

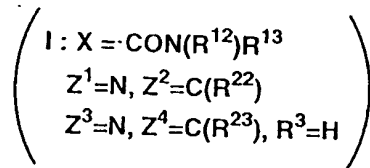
化合物 (XXVII) から化合物 (I) への合成反応については、先に例示したスキーム 1 の条件に準じて行い、目的化合物 (I) へと導くことが出来る。

反応終了後、目的物を単離し、必要に応じて再結晶、蒸留、カラムクロマトグラフィー等の精製手段により、目的化合物を精製出来る。

化合物 (XXVII) のピリダジン-3, 4-ジカルボン酸は、例えば J. Heterocyclic Chem.、30, 1597 (1993) 等を参考にして合成することが出来る。



スキーム 9



(スキーム 9)

スキーム 1 の方法に従い合成したアニライド化合物 (XXXI) を各種の求核試剤

(VIII) と脱水縮合し、本目的化合物 (I : XがCON (R¹²) R¹³)、Z¹=N, Z²=C (R²²), Z³=N, Z⁴=C (R²³), R³=Hの場合) へ導くことが出来る。

化合物 (XXXI) から化合物 (I) への反応で使用出来る溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素などのハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類、アセトニトリル、N, N-ジメチルホルムアミド等の極性非プロトン溶媒類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類、酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸類、アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン類が挙げられ、好ましくはジクロロメタン、クロロホルム、ベンゼン、トルエン又はキシレンが挙げられる。

脱水剤としては、例えば無水酢酸、トリフルオロ酢酸無水物、塩化チオニル、オキシ塩化リン、5 塩化リン、ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミドなどが挙げられ、好ましくは1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミドが挙げられる。

これらの試薬の使用量としては、化合物 (XXXI) に対して過剰モルが好ましく、等モルないし2当量がさらに好ましい。

反応温度は-10℃から不活性溶媒の沸点域から選択すれば良く、好ましくは室温~120℃で行うのが良い。反応時間は反応温度、反応規模等により一定しないが、数分ないし48時間の範囲で行えば良く、好ましくは30分から5時間で行うのが良い。また目的物は必要に応じて抽出、再結晶、蒸留、カラムクロマトグラフィー等の単離手段により精製出来る。

以下に本発明化合物及び中間体の合成例を実施例として具体的に述べるが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

(実施例1)

[1-1]

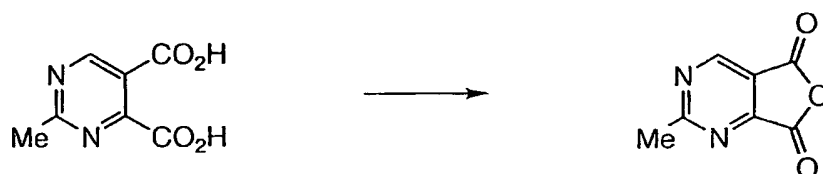
2-メチルピリミジン-4, 5-ジカルボン酸の合成



2-メチルピリミジン-4, 5-ジカルボン酸ジエチル 8.5 g (35.7 mmol) を水酸化ナトリウム 3.3 g (82.5 mmol) のエタノール (40 ml) - 水 (40 ml) 混合溶液中で 3 時間加熱還流した。反応液を放冷した後、濃塩酸を加え酸性溶液とし、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下で溶媒を留去した。得られた結晶をジエチルエーテルで洗浄し、減圧下で乾燥することにより 2-メチルピリミジン-4, 5-ジカルボン酸 1.95 g (10.7 mmol) を得た。融点 260.0 °C ≤

[1-2]

2-メチルピリミジン-4, 5-ジカルボン酸無水物の合成

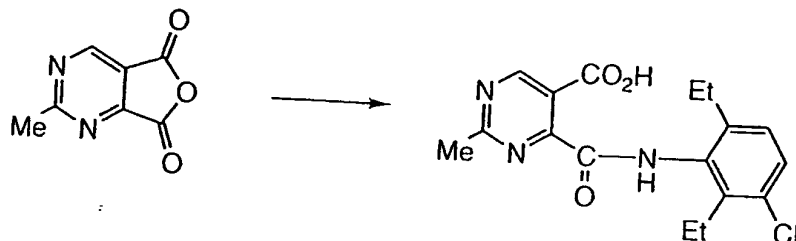


2-メチルピリミジン-4, 5-ジカルボン酸 1.8 g (9.9 mmol) を無水酢酸 20 ml 中で 130 ~ 135 °C に加熱し、1.5 時間攪拌した。放冷後、反応液から溶媒を減圧留去し、残渣にジエチルエーテルを加え、析出した結晶を濾過、乾燥することにより、2-メチルピリミジン-4, 5-ジカルボン酸無水物 1.2 g (7.3 mmol) を得た。なお得られた無水物は、そのまま次の反応に用いた。

[1-3]

2-メチル-4-(3-クロロ-2, 6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)

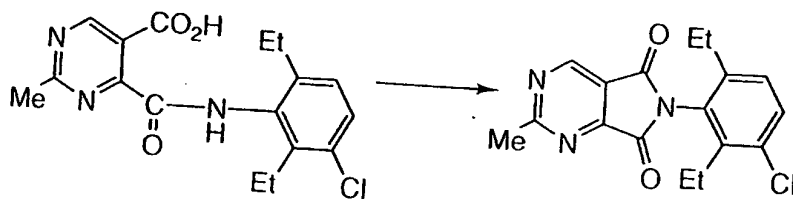
ピリミジン-5-カルボン酸の合成



2-メチルピリミジン-4, 5-ジカルボン酸無水物 0.6 g (3.7 mmol) 及びジクロロメタン 15 ml の溶液に 3-クロロ-2, 6-ジエチルアニリン 0.7 g (3.8 mmol) をジクロロメタン 5 ml に溶かした溶液を室温下に加え、その後 1 時間攪拌した。反応液に水 50 ml 及び濃塩酸 1 ml を加え、クロロホルムで抽出し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。その後溶媒を減圧留去し、残渣にジエチルエーテルを加え、析出した結晶を濾過し、乾燥することにより、2-メチル-4-(3-クロロ-2, 6-ジエチルフェニル) アミノカルボニルピリミジン-5-カルボン酸 0.8 g (2.3 mmol) を得た。融点 216-218℃

[1-4]

2-メチル-N-(3-クロロ-2, 6-ジエチルフェニル) ピリミジン-4, 5-ジカルボキシイミドの合成

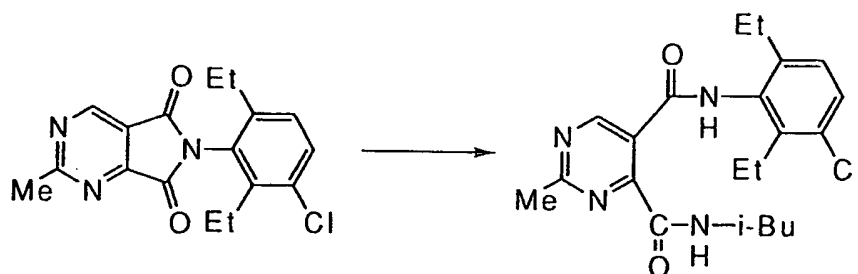


2-メチル-4-(3-クロロ-2, 6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリミジン-5-カルボン酸 0.5 g (1.4 mmol)、酢酸ナトリウム 0.1 g (1.2 mmol) 及び無水酢酸 10 ml の混合物を 110℃ に加熱し、1 時間攪拌した。減圧下で溶媒を留去した後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加

え、酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、そのまま次の反応に用いた。

[1-5]

2-メチル-5-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリミジン-4-カルボン酸イソブチルアミド(化合物No. 1-1)の合成



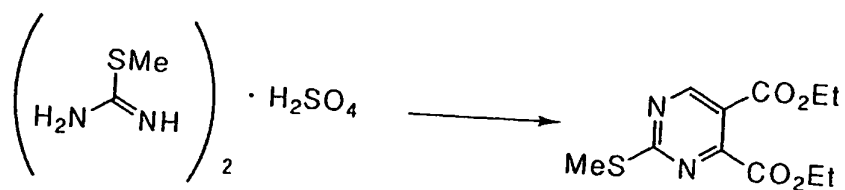
[1-4] で得られた 2-メチル-N-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニル)ピリミジン-4,5-ジカルボキシイミドをジオキサン 10 ml に溶かし、そこにイソブチルアミン 0.11 g (1.5 mmol) を加え、室温で一晩撹拌した。反応終了後、溶媒を減圧下で留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)により精製した。溶媒を減圧下で留去し、ジエチルエーテルで結晶を洗浄し減圧下で乾燥することにより、2-メチル-5-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリミジン-4-カルボン酸イソブチルアミド 0.15 g (0.37 mmol) を得た。

融点 160-162℃

(実施例 2)

[2-1]

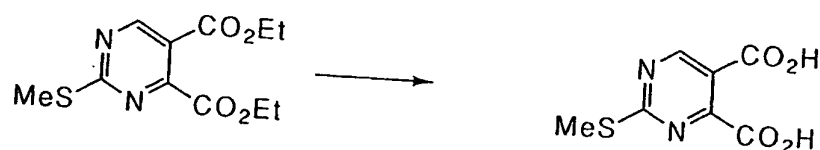
2-メチルチオピリミジン-4,5-ジカルボン酸ジエチルの合成



硫酸メチルイソチオ尿素 8.63 g (31 mmol) のエタノール 120 ml 懸濁溶液に 28% ナトリウムメトキシドのメタノール溶液 12.2 g (63.2 mmol) を加え、室温で 30 分間攪拌した。その後、この懸濁溶液にエトキシメチレンオキサリ酢酸ジエチル 15 g (61 mmol) を加え、室温で 1 晩攪拌した。反応終了後、大部分のエタノールを減圧下留去し、これに水を加え、クロロホルムで抽出した。クロロホルム層を希塩酸及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を減圧留去することにより 2-メチルチオピリジン-4, 5-ジカルボン酸ジエチル 14.97 g (55 mmol) を得た。このジエステル体は、そのまま次の反応に用いた。

[2-2]

2-メチルチオピリジン-4, 5-ジカルボン酸の合成



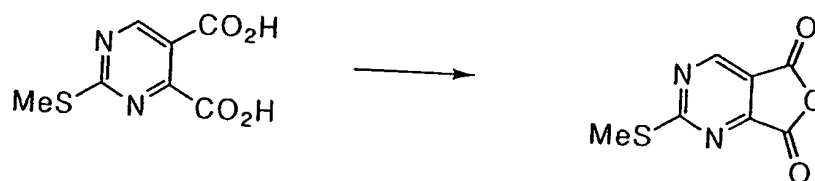
[2-1] で得られた 2-メチルチオピリジン-4, 5-ジカルボン酸ジエチル 14.92 g (55 mmol) のエタノール 120 ml 溶液に NaOH/H₂O [4.44 g (111 mmol) / 80 ml] を加え、室温で 1.5 時間攪拌した。反応終了後、大部分のエタノールを減圧留去し不溶物を減圧濾過した。濾液 (水溶液) に pH 1 になるまで濃塩酸を加え、酢酸エチルにより抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、溶媒を減圧留去した。析出した結晶を、ジエチルエーテルで洗浄し、減圧濾過、乾

燥することにより、2-メチルピリミジン-4, 5-ジカルボン酸の白色結晶 7.21 g (34 mmol) を得た。

融点 181-184℃分解

[2-3]

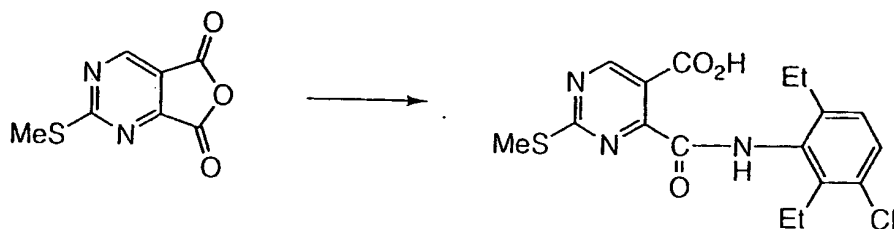
2-メチルチオピリミジン-4, 5-ジカルボン酸無水物の合成



2-メチルチオピリミジン-4, 5-ジカルボン酸 2 g (9.3 mmol) の無水酢酸 20 ml 溶液を、120℃ (オイルバス温度) で1時間加熱撹拌した。反応液から過剰の無水酢酸及び酢酸を減圧留去して、2-メチルチオピリミジン-4, 5-ジカルボン酸無水物を得た。このジカルボン酸無水物は精製することなく次の反応に用いた。

[2-4]

2-メチルチオ-4-(3-クロロ-2, 6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリミジン-5-カルボン酸の合成



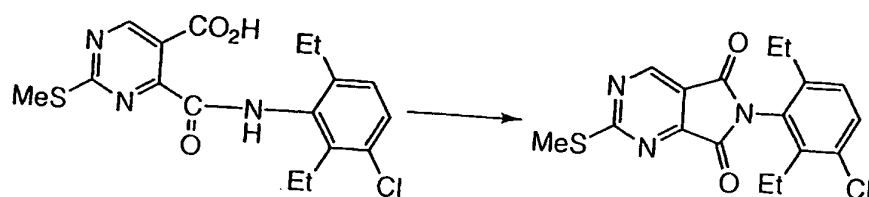
[2-3] で得られた、2-メチルチオピリミジン-4, 5-ジカルボン酸無水物に THF 20 ml 及び 3-クロロ-2, 6-ジエチルアニリン 1.72 g (9.4 mmol) を加え (発熱) 室温で2時間撹拌した。反応終了後減圧下で

溶媒を留去し、水及び濃塩酸を加え pH 1~2 とした。酢酸エチルにより抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧留去した。析出した結晶をジエチルエーテルで洗浄し、減圧濾過、乾燥することにより 2-メチルチオ-4-(3-クロロ-2, 6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリミジン-5-カルボン酸 1.79 g (4.7 mmol) を得た。

融点 214-218℃ (分解)

[2-5]

2-メチルチオ-N-(3-クロロ-2, 6-ジエチルフェニル)ピリミジン-4, 5-ジカルボキシイミドの合成

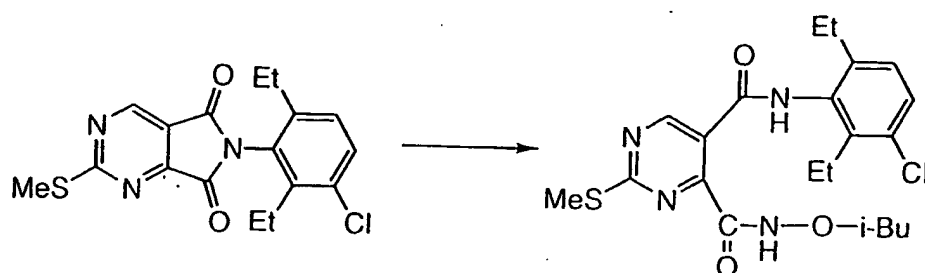


2-メチルチオ-4-(3-クロロ-2, 6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリミジン-5-カルボン酸 1 g (2.6 mmol)、酢酸ナトリウム 0.1 g (1.2 mmol) 及び無水酢酸 50 ml の混合液を 130℃ (オイルバス温) で 1 時間加熱撹拌した。反応終了後、過剰の無水酢酸を減圧留去し酢酸エチルを加えた。これを飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧留去した。残渣をヘキサンにて結晶化し、減圧濾過、乾燥することにより 2-メチルチオ-N-(3-クロロ-2, 6-ジエチルフェニル)ピリミジン-4, 5-ジカルボキシイミド 0.89 g (2.5 mmol) を得た。

融点 141-143℃

[2-6]

2-メチルチオ-5-(3-クロロ-2, 6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリミジン-4-カルボン酸 i-ブチルオキシアミド (化合物 No. 1-14) の合成

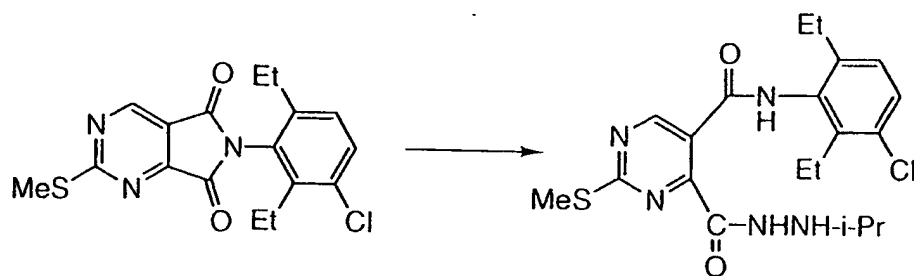


2-メチルチオ-N-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニル)ピリミジン-4,5-ジカルボキシイミド 0.71 g (2 mmol)、O-イソブチルヒドロキシアミン塩酸塩 0.25 g (2 mmol) 及び DMF 10 ml の混合液にカリウム-tert-ブトキシド 0.45 g (4 mmol) を加え、室温で2時間撹拌した。反応液を氷水に注ぎ濃塩酸を加え、pH 2 とした。クロロホルムにより抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、溶媒を減圧留去した。TLC 分取 (ヘキサン：酢酸エチル = 3 : 1) により精製した。溶媒留去により析出した結晶をヘキサンのジエチルエーテル混合溶液で洗浄し、減圧濾過、乾燥することにより 2-メチルチオ-5-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリミジン-4-カルボン酸 i-ブチルオキシアミド 70 mg (0.16 mmol) を得た。

融点 174-176℃

(実施例 3)

2-メチルチオ-5-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリミジン-4-カルボン酸 i-プロピルヒドラジド (化合物 No. 1-13) の合成

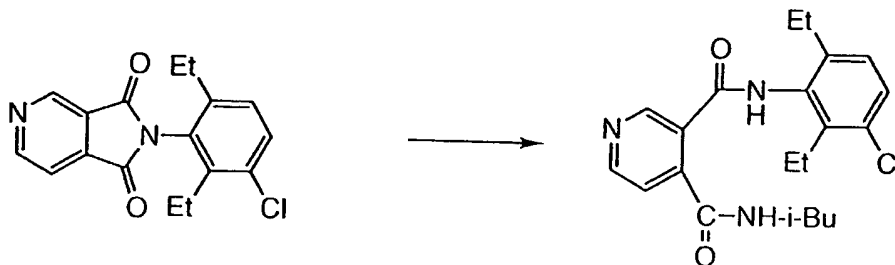


イソプロピルヒドラジン 0.2 g (2.7 mmol)、ジオキサン 10 ml 及び 2-メチルチオ-N-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニル)ピリジン-4,5-ジカルボキシイミド 0.5 g (1.4 mmol) の混合溶液を室温で 1 晩撹拌した。反応終了後溶媒及び過剰のイソプロピルヒドラジンを減圧留去し、TLC 分取 (ヘキサン：酢酸エチル = 1 : 1) により精製した。得られた結晶を、ヘキサン-ジエチルエーテルの混合溶媒で洗浄し、減圧濾過、乾燥することにより、2-メチルチオ-5-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリジン-4-カルボン酸 i-プロピルヒドラジド 0.17 g (0.4 mmol) を得た。

融点 161-163℃

(実施例 4)

3-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリジン-4-カルボン酸 i-ブチルアミド (化合物 No. 2-1) の合成



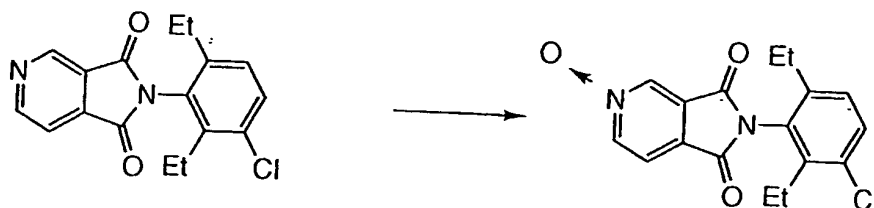
イソブチルアミン 0.18 g (2.5 mmol)、ジオキサン 15 ml 及び N-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニル)ピリジン-3,4-ジカルボキシイミド 0.5 g (1.6 mmol) の混合液を室温で 2 日間撹拌した。反応終了後溶媒及び過剰のイソブチルアミンを減圧留去し、ジエチルエーテルで結晶化させ、減圧濾過、乾燥することにより、3-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリジン-4-カルボン酸 i-ブチルアミド 0.5 g (1.3 mmol) を得た。

融点 183-186℃

(実施例 5)

[5-1]

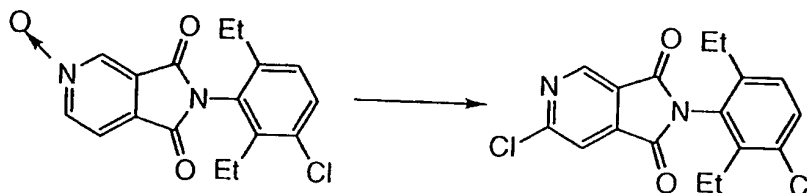
N-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニル)ピリジン-3,4-ジカルボキシイミド1-オキシドの合成



N-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニル)ピリジン-4,5-ジカルボキシイミド1.5 gをクロロホルム15 mlに溶解し、次いで3-クロロ過安息香酸1.7 gを加え還流下5時間反応を行った。反応終了後、反応溶液を室温に戻した後酢酸エチルを加え有機層を飽和重ソウ水で3回洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮し、得られた残留物にジエチルエーテルを加え、注意深く攪拌すると結晶が析出し、これを濾別することにより目的物0.85 gを得た。これはそのまま次の反応に用いた。

[5-2]

6-クロロ-N-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニル)ピリジン-3,4-ジカルボキシイミドの合成

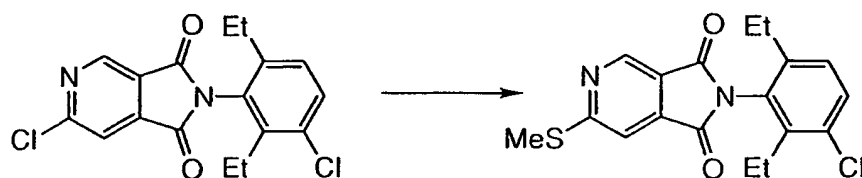


N-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニル)ピリジン-3,4-ジカルボキシイミド1-オキシド500 mgをオキシ塩化リン5 mlに溶解し、徐々に加熱を行い、還流下に3時間反応を行った。反応終了後、反応溶液を室温に戻した後、減圧下に過剰のオキシ塩化リンを留去した後、残留物に酢酸エチルを加

え有機層を注意深く飽和重ソウ水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた結晶を少量のジエチルエーテルで洗浄することにより、目的物 500 mg を得た。これはそのまま次の反応に用いた。

[5 - 3]

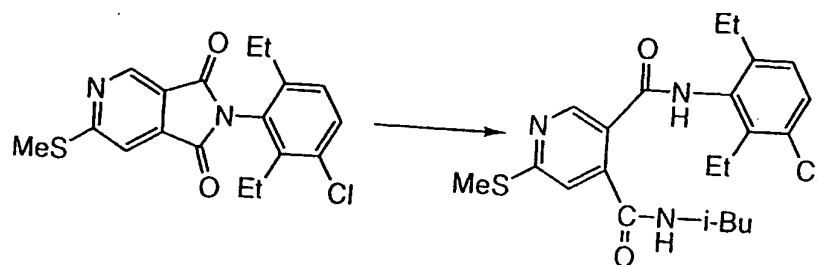
6-メチルチオ-N-(3-クロロ-2, 6-ジエチルフェニル)ピリジン-3, 4-ジカルボキシイミドの合成



6-クロロ-N-(3-クロロ-2, 6-ジエチルフェニル)ピリジン-3, 4-ジカルボキシイミド 500 mg をジメチルホルムアミド 3 ml に溶解した溶液に、メチルメルカプタンナトリウム水溶液 (15% 水溶液、0.75 ml) を 0℃ でゆっくり加え、1 時間反応を行い、原料化合物の消失を確認した後、水を加え、酢酸エチルで反応系より目的物を抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に溶媒を留去し、得られた残渣を少量のエーテルで洗浄することにより目的物 300 mg を得た。これはそのまま次の反応に用いた。

[5 - 4]

6-メチルチオ-3-(3-クロロ-2, 6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)-ピリジン-4-カルボン酸 i-ブチルアミド (化合物 No. 2-2) の合成



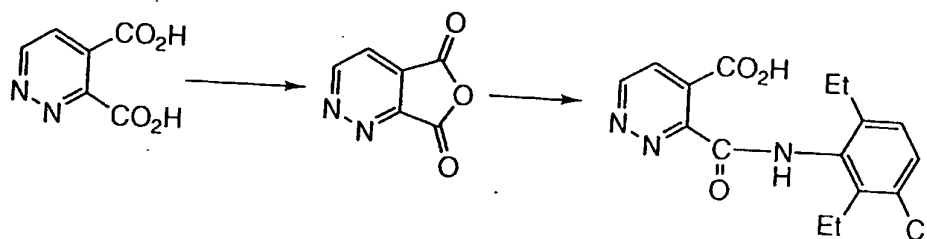
6-メチルチオ-N-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニル)ピリジン-3,4-ジカルボキシイミド 300 mg をジオキサン 3 ml に溶解し、該溶液に i-ブチルアミン 125 mg を加えて、室温下に 12 時間反応を行った。反応終了後、反応液を減圧下に留去し、得られた残渣を酢酸エチル/n-ヘキサンを溶離剤とするシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することにより、白色結晶として目的物 180 mg を得た。

融点 238-242℃

(実施例 6)

[6-1]

3-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリダジン-4-カルボン酸の合成



ピリダジン-3,4-ジカルボン酸 1.4 g (8.3 mmol) をベンゼン 20 ml に懸濁し、塩化チオニル 10 ml を加え 1 時間加熱還流した。放冷後、減圧下で溶媒を留去し、ピリダジン-3,4-ジカルボン酸無水物を得た。

ついで、このものをジクロロメタン 30 ml に溶解し、水冷下で 3-クロロ-2,6-ジエチルアニリン 1 g (5.4 mmol) を滴下した。

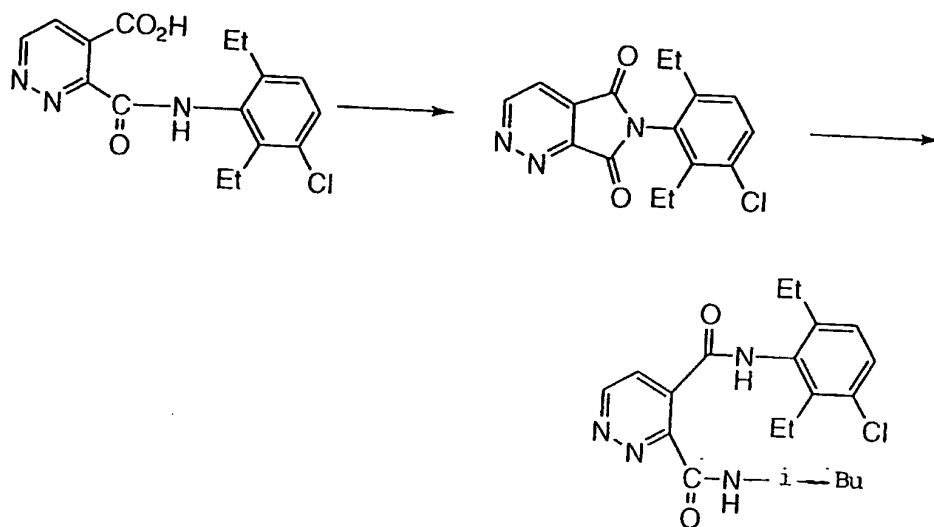
この反応混合物を室温で一晩攪拌した後、10%塩酸に注ぎ込み、クロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥させた後、減圧下で溶媒を留去した。

得られた結晶をヘキサン-エーテルの混合溶媒にて洗浄し、濾取して乾燥させることにより、目的とする3-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリダジン-4-カルボン酸1.35gを得た。

融点 166-172℃ (分解)

[6-2]

4-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリダジン-3-カルボン酸イソブチルアミド (化合物No. 4-1) の合成



3-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリダジン-4-カルボン酸1g (3mmol) をトリフルオロ酢酸15mlに溶解し、無水トリフルオロ酢酸0.63g (3mmol) を加え30分間加熱還流した。放冷後、減圧下で溶媒を留去すると、N-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリダジン-3,4-ジカルボキシイミドが粗物で得られた。

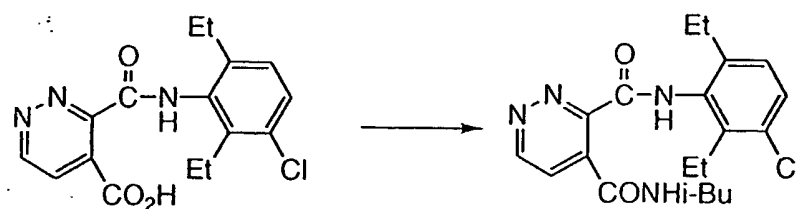
ついでこのものをジオキサン10mlに溶解し、10mlのジオキサンに溶解

したイソブチルアミン 0.4 g (5.47 mmol) を滴下した。この反応液をそのまま 1 時間攪拌し、減圧下で溶媒を留去した。得られた残渣をプレパラティブ薄層クロマトグラフィー (ヘキサン/酢酸エチル = 1/2) にて精製し、得られた結晶をイソプロピルエーテルにて洗浄し、濾取することにより、4-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリダジン-3-カルボン酸イソブチルアミド 0.44 g を得た。

融点 127-129℃

(実施例 7)

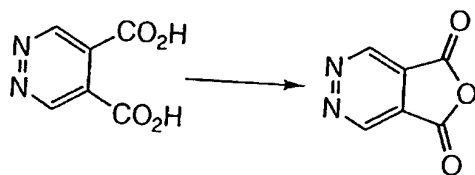
3-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリダジン-4-カルボン酸イソブチルアミド (化合物 No. 5-1) の合成



3-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリダジン-4-カルボン酸 0.7 g (2.1 mmol)、イソブチルアミン 0.31 g (4.2 mmol) 4-ジメチルアミノピリジン 10 mg (0.08 mmol) 及び塩化メチレン 30 ml の混合溶液に、室温で 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド塩酸塩 1 g (5.2 mmol) を加え、5 時間攪拌した。反応液に水及び濃塩酸を加え、pH 2 とした。有機を分離後、水層をクロロホルムで抽出し、有機層と合わせ、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下で溶媒を留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (PTLC) (ヘキサン/酢酸エチル = 1/1) にて精製した後、ヘキサン/ジエチルエーテルにて結晶化させ濾取、減圧乾燥により、3-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリダジン-4-カルボン酸イソブチルアミド 0.24 g (0.6 mmol) を得た。融点 135-137℃ (実施例 8)

[8 - 1]

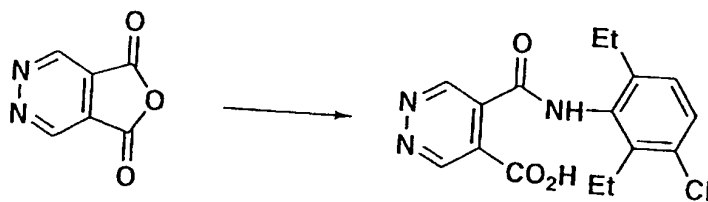
ピリダジン-4, 5-ジカルボン酸無水物の合成



ピリダジン-4, 5-ジカルボン酸 1 g と DCC 1.23 g を THF 20 ml に溶解し、一晚室温にて攪拌した。反応終了後、反応液を濾過し、それ以上精製することなく濾液を次の反応に供した。

[8 - 2]

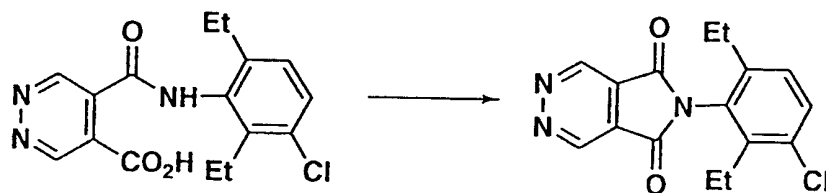
4-(3-クロロ-2, 6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)-ピリダジン-5-カルボン酸の合成



前述濾液に 3-クロロ-2, 6-ジエチルアニリン 1.1 g を加え、室温で一晩攪拌した。反応終了後、反応液を濾過、結晶をジエチルエーテルで洗浄し、粗結晶として 1.3 g を得た。それ以上精製することなく次の反応に供した。

[8 - 3]

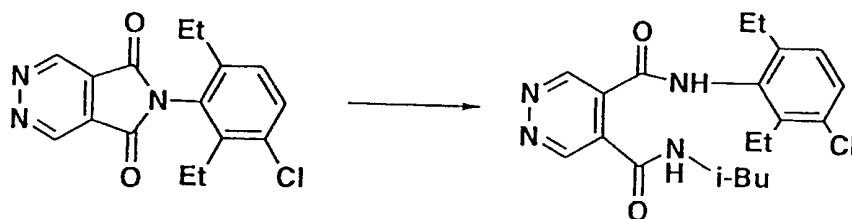
N-(3-クロロ-2, 6-ジエチルフェニル)ピリダジン-4, 5-ジカルボキシイミドの合成



前述粗結晶 0.65 g と DCC 0.4 g を THF 10 ml に溶解し、室温で一晩攪拌した。反応終了後、反応液を濾過し、濾液を濃縮後カラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル、4：1）に供し、目的物 500 mg を得た。融点 148～150℃

[8-4]

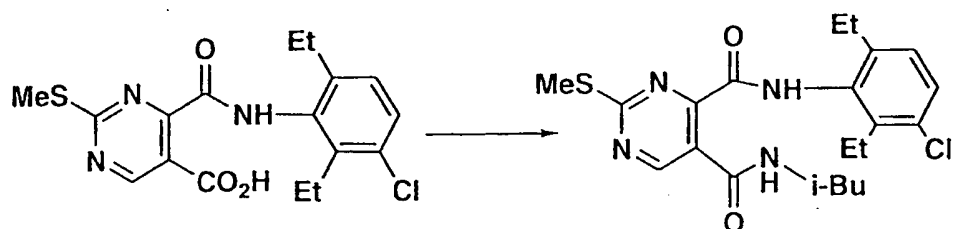
4-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリダジン-5-カルボン酸 i-ブチルアミド (化合物 No. 6-1) の合成



N-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニル)ピリダジン-4,5-ジカルボキシイミド 0.25 g と イソブチルアミン 0.12 g を ジオキサン 10 ml に溶解し、室温にて一晩攪拌した。反応終了後反応液を濃縮し、ジエチルエーテルで洗浄し目的物を 0.25 g 得た。融点 177～180℃

(実施例 9)

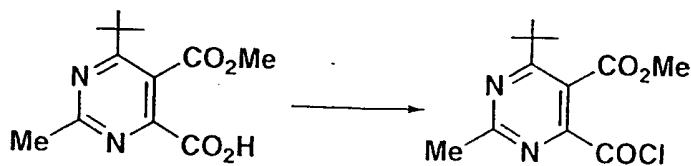
2-メチルチオ-6-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリミジン-5-カルボン酸 i-ブチルアミド (化合物 No. 8-1) の合成



2-メチルチオ-6-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)ピリミジン-5-カルボン酸 0.5 g (1.3 mmol)、イソブチルアミン 0.15 g (2 mmol)、4-ジメチルアミノピリジン (触媒量) 及びトルエン 10 ml の混合液を 70℃ に加熱した。そこに 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド塩酸塩 (WSC) 0.5 g (2.6 mmol) を加え、1 時間攪拌した。反応液を室温になるまで放置した後、希塩酸水溶液に注ぎクロロホルムにて抽出した。Na₂SO₄にて乾燥後減圧下で溶媒を留去した。シリカゲルクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル=3：2) により精製した後結晶化 (ヘキサン、ジエチルエーテル) し、減圧濾過、乾燥することによって (化合物 No. 8-1) を 0.13 g 得た。融点 179~183℃ (実施例 10)

[10-1]

2-メチル-6-tert-ブチル-5-メトキシカルボニル-4-ピリミジンカルボン酸クロライドの合成

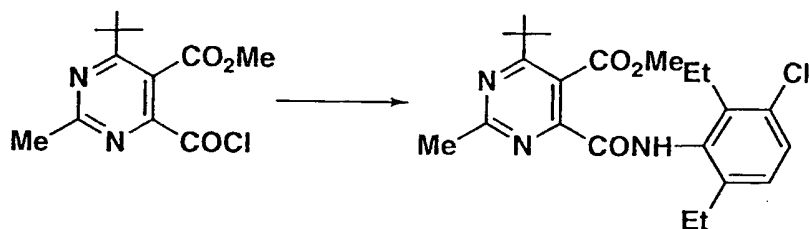


2-メチル-6-tert-ブチル-5-メトキシカルボニル-4-ピリミジンカルボン酸 5 g (22 mmol)、塩化チオニル 5 g (42 mmol) 及びベンゼン 50 ml の混合物を、1 時間加熱還流した。室温まで放置した後、過剰の塩化チ

オニル及び溶媒を減圧下で留去することにより、2-メチル-6-tert-ブチル-5-メトキシカルボニル-4-ピリミジンカルボン酸クロライドの粗物を油状物として得た。得られたピリミジンカルボン酸クロライドは、そのまますぐに次の反応に用いた。

[10-2]

2-メチル-6-tert-ブチル-4-(2,6-ジエチル-3-クロロフェニルアミノカルボニル)-5-ピリミジンカルボン酸メチルエステルの合成

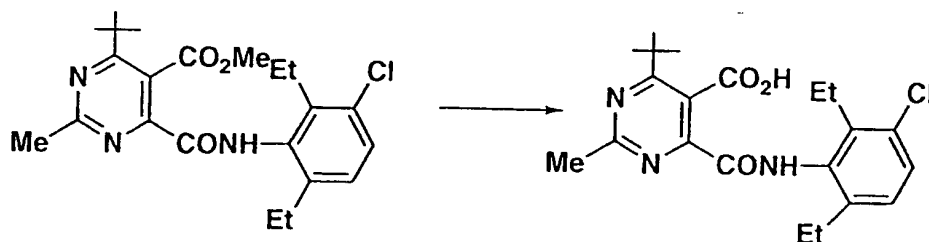


[10-1] で得られた2-メチル-6-tert-ブチル-5-メトキシカルボニル-4-ピリミジンカルボン酸クロライドのジクロロメタン (50 ml) 溶液を氷水で冷却し、そこに、2,6-ジエチル-3-クロロアニリン 5 g (27 mmol)、トリエチルアミン 3 g (30 mmol) 及びジクロロメタン 20 ml の混合物をゆっくり加え、室温までもどし室温で3時間攪拌した。

その後反応液を希塩酸水溶液及び、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝1：1）により上記化合物の粗物 9.3 g を油状物として得た。得られた粗物は、それ以上精製せず次の反応に用いた。

(実施例 10-3)

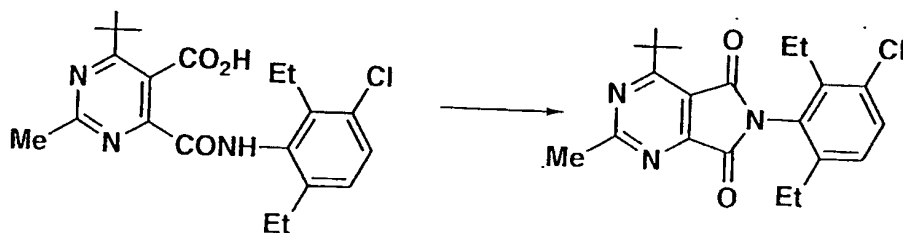
2-メチル-6-tert-ブチル-4-(2,6-ジエチル-3-クロロフェニル)アミノカルボニル-5-ピリミジンカルボン酸の合成



(実施例 10-2) で得られた 2-メチル-6-tert-ブチル-4-(2,6-ジエチル-3-クロロフェニル) アミノカルボニル-5-ピリミジンカルボン酸メチルエステルの粗物 9.3 g のエタノール (20 ml) 溶液に、水酸化ナトリウム 1 g (23 mmol) の水溶液 30 ml を加え、室温で 15 時間攪拌した。その後減圧下で大部分のエタノールを留去し、残った水溶液をクロロホルムで洗浄した。水溶液に濃塩酸を加え、pH 2 とし、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。残渣をエチルエーテル-ヘキサン溶液にて結晶化し、減圧濾過乾燥することによって上記ピリミジンカルボン酸を 2.8 g (6.9 mmol) 得た。融点 142 ~ 144 °C 分解

[10-4]

2-メチル-6-tert-ブチル-N-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニル)ピリミジン-4,5-ジカルボキシイミドの合成

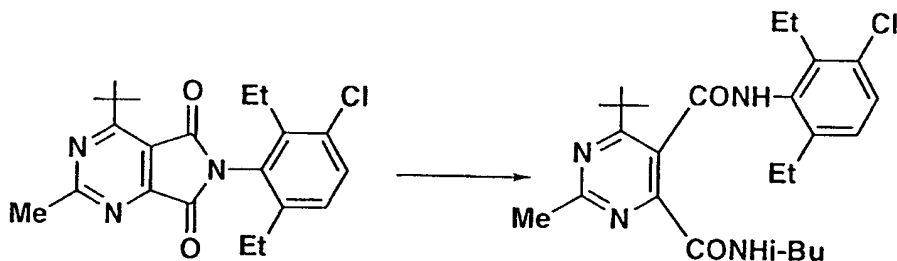


2-メチル-6-tert-ブチル-4-(2,6-ジエチル-3-クロロフェニル) アミノカルボニル-5-ピリミジンカルボン酸 2.4 g (5.9 mmol)、酢酸ナトリウム (触媒量) 及び無水酢酸 20 ml の混合物を 110 °C に加熱下、45 分間攪拌した。減圧下で溶媒を留去し、クロロホルムを加えた。クロロホルム

ム溶液を、飽和炭酸水素ナトリウム溶液にゆっくり注ぎ、30分間攪拌した。クロロホルム層と水層を分離し、水層をクロロホルムにて抽出し、前のクロロホルム層と合わせて、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、エチルエーテル-ヘキサン混合溶液を加え、不溶物を除去した。溶媒を減圧留去することによって、イミド体を1.8g (4.7mmol) 得た。これはそのまま次の反応に用いた。

[10-5]

2-メチル-5-(3-クロロ-2,6-ジエチルフェニルアミノカルボニル)-6-イソブチルピリミジン-4-カルボン酸イソブチルアミド (化合物No. 3-29) の合成



イミド体0.6g (1.6mmol) の1,4-ジオキサン (20ml) 溶液にイソブチルアミン0.2g (2.7mmol) を加え、室温で2時間攪拌した。過剰のアミン及び溶媒を減圧留去し、析出した結晶をエチルエーテルで洗浄し、減圧下で乾燥させることにより、目的化合物を0.4g (0.9mmol) 得た。融点217~219℃ (分解)

前記実施例に準じて合成した本発明化合物の構造式と物性を前記実施例を含め、それぞれ第1表~第8表に示す。

〔第 1 表〕

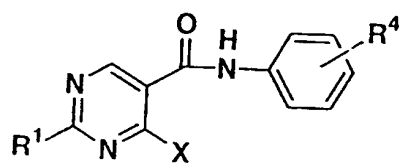


表 1

化合物 No.	R ¹	X	R ⁴	物性値
1-1	H	CONHiBu	2-Me-3-Cl	mp181-182℃
1-2	Me	CO ₂ H	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp155-157℃
1-3	Me	CO ₂ Me	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp165-168℃
1-4	Me	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp160-162℃
1-5	i-Pr	CONHiBu	2-Me-3-Cl	mp190-194℃
1-6	i-Pr	CONHcPen	2-Me-3-Cl	mp170-172℃
1-7	i-Pr	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp126-129℃
1-8	i-Pr	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp 87- 90℃
1-9	SMe	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp134-135℃
1-10	SMe	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp121-123℃
1-11	SMe	CONHiBu	2-Me-3-Cl	mp168-169℃
1-12	SMe	CONHcPen	2-Me-3-Cl	mp163-167℃
1-13	SMe	CONHNHiPr	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp161-163℃
1-14	SMe	CONHOiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp174-176℃
1-15	SMe	CONHiBu	2-Me-5-Cl	mp205-210℃
1-16	Ph	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp188-192℃
1-17	Ph	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp207-210℃
1-18	Ph	CONHiBu	2-Me-3-Cl	mp230-234℃
1-19	Ph	CONHcPen	2-Me-3-Cl	mp239-241℃
1-20	Ph	CONHNHiPr	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp195-198℃
1-21	OMe	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp165-170℃
1-22	OEt	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp150-153℃
1-23	Me ₂ N	CONHiBu	2-Me-3-Cl	mp203-205℃

表 2

化合物 No.	R ¹	X	R ⁴	物性値
1-24	Me ₂ N	CONHcPen	2-Me-3-Cl	mp174-175℃
1-25	Me ₂ N	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp150-151℃
1-26	Me ₂ N	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp131-133℃
1-27	iBuNH	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp228-232℃
1-28	MeSO ₂	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp177-180℃
1-28	MeNH	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp180-191℃
1-29	SCH ₂ CO ₂ Et	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp164-167℃
1-30	OCH ₂ CO ₂ Et	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp161-163℃
1-31	SMe	CONHG(b)	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp178-181℃
1-32	SMe	CONHCH(Me)Ph	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp170-171℃
1-33	OPh	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp165-167℃
1-34	SMe	CONH(CH ₂) ₂ OH	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp185-188℃
1-35	MeSO ₂ NH	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp200℃<(dec)
1-36	F	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp150-152℃
1-37	Me	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp164-166℃
1-38	Me ₂ N	CONH(CH ₂) ₂ OH	2-Me-3-Cl	mp142-144℃
1-39	EtSO ₂ NMe	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp180-183℃
1-40	OH	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp200-202℃
1-41	OCH ₂ C≡CH	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp168-169℃
1-42	OCH ₂ CF ₃	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp156-159℃
1-43	OPh(4-CF ₃ -2-Cl)	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp187-189℃
1-44	c-Pr	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp174-176℃
1-45	c-Pr	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp148-150℃

表 3

化合物 No.	R ¹	X	R ¹	物性値
1-46	CN	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp217-219℃
1-47	c-Pr	CONHiBu	2-Me-3-Cl	mp156-158℃
1-48	c-Pr	CONHcPen	2-Me-3-Cl	mp167-169℃
1-49	Me	CONHcPr	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp205-206℃
1-50	(CH ₂) ₄ N	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp154-156℃
1-51	Et ₂ N	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp176-178℃
1-52	(CH ₂) ₃ N	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp187-190℃
1-53	MeS	CONHiBu	2,6-Et ₂	mp164-167℃
1-54	MeS	CONHcPen	2,6-Et ₂	mp175-177℃
1-55	MeS	CONHiBu	2-F-4-Cl	mp172-174℃
1-56	MeS	CONHcPen	2-F-4-Cl	mp195-197℃
1-57	F(CH ₂) ₂ O	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp151-153℃
1-58	Cl(CH ₂) ₂ O	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp136-138℃
1-59	c-PrNH	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp214-216℃
1-60	PhCH ₂ O	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp143-145℃
1-61	(EtO) ₂ CHCH ₂ NH	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp196-198℃
1-62	Pr	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp130-133℃
1-63	Pr	CONHiBu	2-Me-3-Cl	mp148-150℃
1-64	Pr	CONHcPen	2-Me-3-Cl	mp160-162℃
1-65	Et	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp146-148℃
1-66	Et	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp135-138℃
1-67	Et	CONHiBu	2-Me-3-Cl	mp145-147℃
1-68	Et	CONHcPen	2-Me-3-Cl	mp159-160℃

表 4

化合物 No.	R ¹	X	R ⁴	物性値
1-69	tBu	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp148-150℃
1-70	tBu	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp155-157℃
1-71	tBu	CONHcPen	2-Me-3-Cl	mp229-231℃
1-72	tBu	CONHcPen	2-Me-3-Cl	mp214-217℃
1-73	CF ₃	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp210-212℃
1-74	CF ₃	CONHcPr	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp261-262℃
1-75	CF ₃	CONHiBu	2-Me-3-Cl	mp198-200℃
1-76	CF ₃	CONHcPen	2-Me-3-Cl	mp233-234℃
1-77	CF ₃	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp217-219℃
1-78	CF ₃	CONHCH ₂ CH=CH ₂	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp234-236℃
1-79	CF ₃	CONHCH ₂ C≡CH	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp234℃

〔第 2 表〕

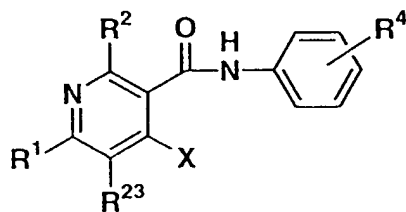


表 5

化合物No.	R ¹	R ²	R ^{2,3}	X	R ⁴	物性値
2-1	H	H	H	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp183-186℃
2-2	MeS	H	H	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp238-242℃
2-3	Me	H	MeO	CONHiBu	2-Me-3-Cl	mp173-175℃
2-4	Cl	H	H	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp235-237℃
2-5	Me ₂ N	H	H	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp222-224℃
2-6	MeO	H	H	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp258-260℃
2-7	H	Me ₂ N	H	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp212-214℃
2-8	MeSO	H	H	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp205-206℃
2-9	H	OH	H	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp259-262℃
2-10	Me	H	MeO	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp235-237℃
2-11	H	OH	H	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp227-239℃
2-12	H	MeS	H	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp247-250℃
2-13	H	MeS	H	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp228-230℃
2-14	CN	H	H	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp242-243℃

〔第3表〕

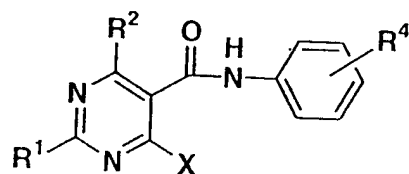
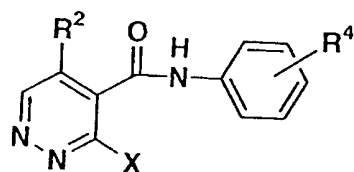


表 6

化合物No.	R ¹	R ²	X	R ⁴	物性値
3-1	Me	Me	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp249-253℃
3-2	Me	Me	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp245-247℃
3-3	Me	Me	CONHiBu	2-Me-3-Cl	mp197-200℃
3-4	Me	Me	CONHcPen	2-Me-3-Cl	mp180-182℃
3-5	Me	Et	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp235-238℃
3-6	Me	Et	CONHiBu	2-Me-3-Cl	mp210-212℃
3-7	Me	Et	CONHcPen	2-Me-3-Cl	mp225-227℃
3-8	Me	Et	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp221-224℃
3-9	Me	Ph	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp241-243℃
3-10	Me	Ph	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp253-256℃
3-11	Me	Ph	CONHiBu	2-Me-3-Cl	mp210-214℃
3-12	Me	Ph	CONHcPen	2-Me-3-Cl	mp227-229℃
3-13	Et	Me	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp235-238℃
3-14	Et	Me	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp238-242℃
3-15	Et	Me	CON(CH ₂) ₄	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp172-174℃
3-16	Me	iPr	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp230-233℃
3-17	Me	Ph(2-F)	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp210-212℃
3-18	Me	Ph(2-F)	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp208-210℃
3-19	H	Me	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp250-252℃
3-20	H	Me	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp232-235℃
3-21	H	Me	CONHiBu	2-Me-3-Cl	mp209-212℃
3-22	H	Me	CONHcPen	2-Me-3-Cl	mp218-220℃
3-23	Me	CF ₃	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp285-288℃

表 7

化合物No.	R ¹	R ²	X	R ⁴	物性値
3-24	Me	CF ₃	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp280-285℃
3-25	Me	Pr	CONHiBu	2-Me-3-Cl	mp204-205.5℃
3-26	Me	Pr	CONHcPen	2-Me-3-Cl	mp207-209℃
3-27	Me	Pr	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp254-255℃
3-28	Me	Pr	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp251-252℃
3-29	Me	t-Bu	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp217-219℃
3-30	Me	t-Bu	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp207-210℃
3-31	Me	t-Bu	CONHPr	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp214-216℃
3-32	CF ₃	Me	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp249-251℃
3-33	CF ₃	Me	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp245-247℃
3-34	CF ₃	Me	CON(CH ₂) ₄	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp228-230℃
3-35	Me	Me	CONHMe	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp279-280℃
3-36	Me	Me	CONHEt	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp279-280℃
3-37	Me	Me	CONHPr	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp277-278℃
3-38	Me	CF ₃	CON(CH ₂) ₄	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp247-250℃
3-39	Me	MeOCH ₂	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp220-222℃
3-40	Me	MeOCH ₂	CONHiBu	2-Me-3-Cl	mp197-200℃



〔第 4 表〕

表 8

化合物 No.	R ²	X	R ⁴	物性値
4-1	H	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp127-129℃
4-2	H	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp120-121℃
4-3	H	CONHiBu	2-Et-6-Me	mp153-156℃
4-4	H	CON(Me)iBu	2-Me-3-Cl	mp109-111℃

〔第 5 表〕

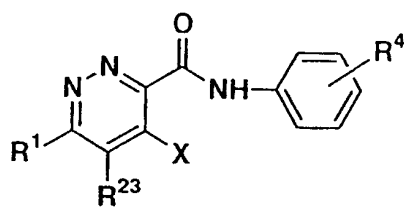


表 9

化合物 No.	R ¹	R ²³	X	R ⁴	物性値
5-1	H	H	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp135-137℃

〔第 6 表〕

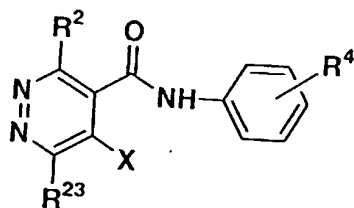


表 10

化合物 No.	R ²	R ²³	X	R ⁴	物性値
6-1	H	H	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp177-180℃
6-2	H	H	CONHcPen	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp145-150℃
6-3	H	H	CONHiBu	2-Me-3-Cl	mp189-190℃
6-4	H	H	CONHcPen	2-Me-3-Cl	mp164-166℃
6-5	H	H	CONHiBu	2-Et-6-Me	mp205-207℃

〔第 7 表〕

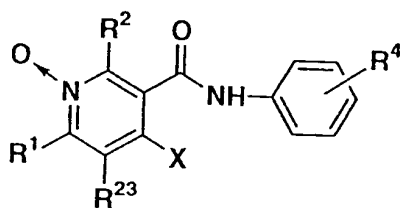


表 11

化合物 No.	R ¹	R ²	R ²³	X	R ⁴	物性値
7-1	H	H	H	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp204-206℃

〔第 8 表〕

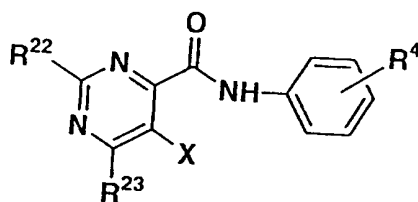
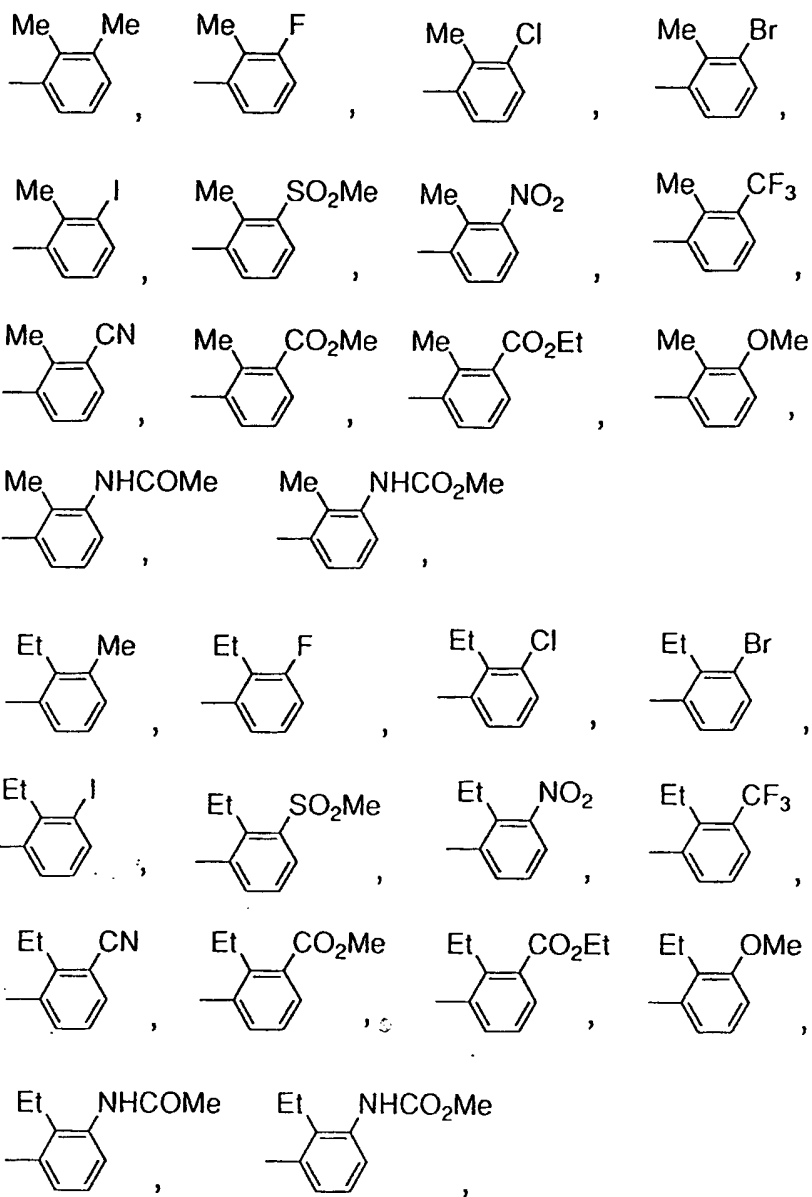


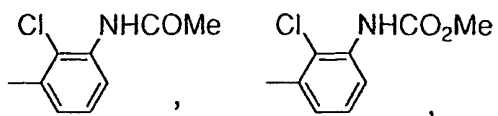
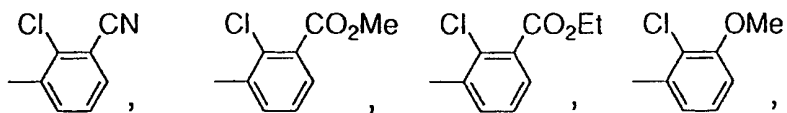
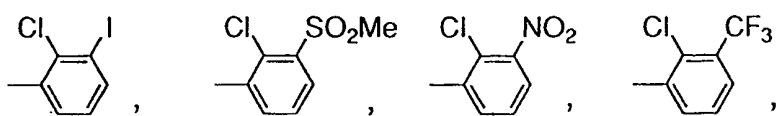
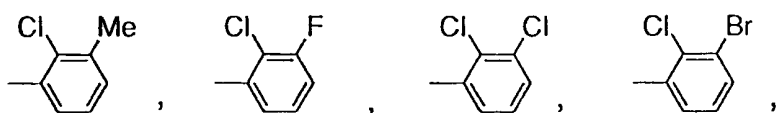
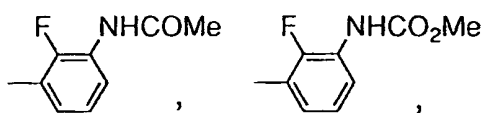
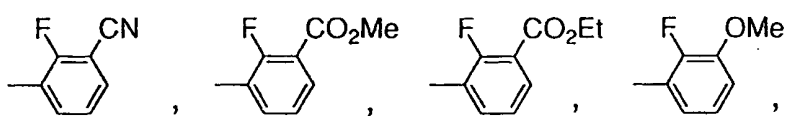
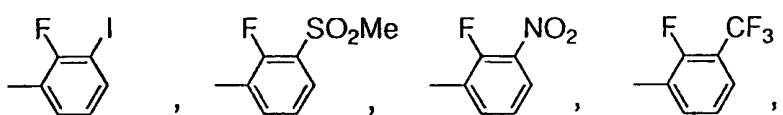
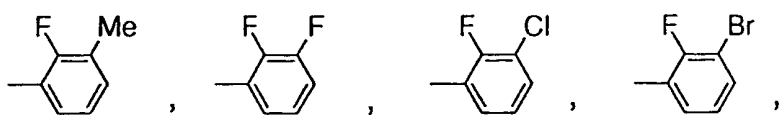
表 1 2

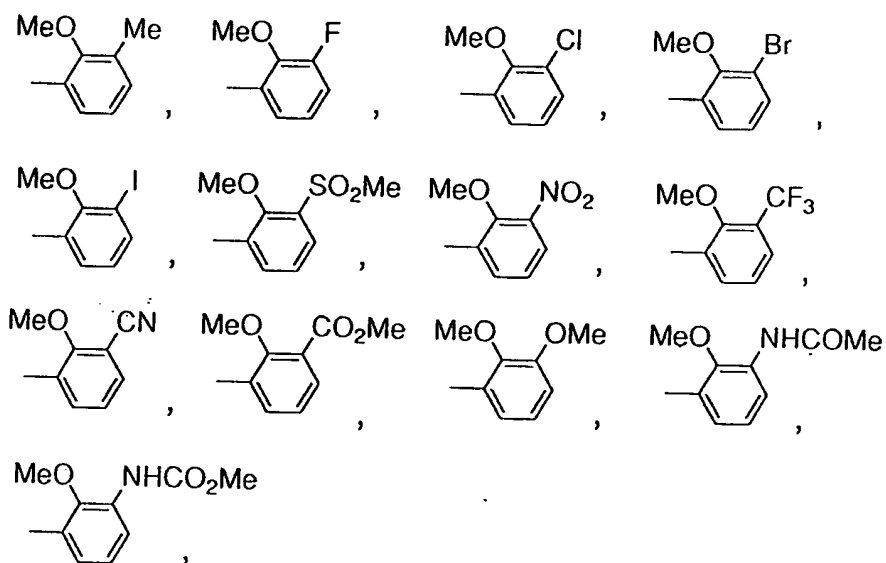
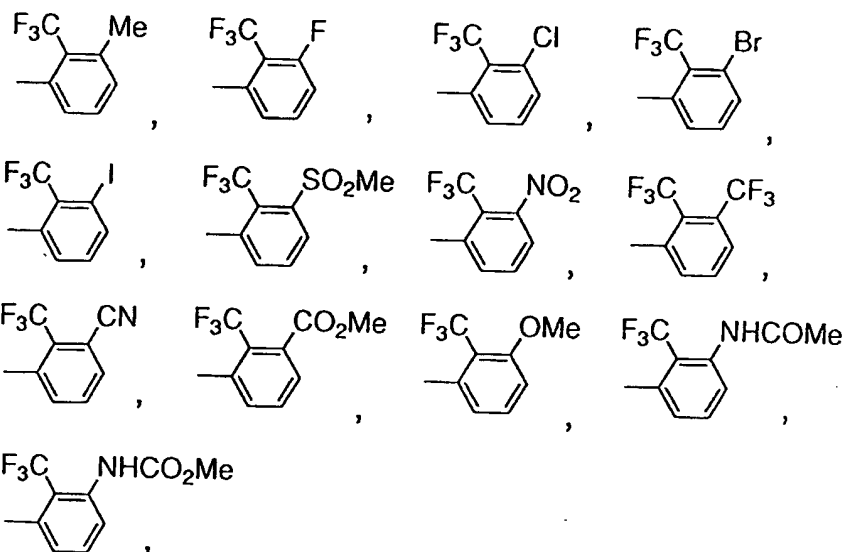
化合物 No.	R ²²	R ²³	X	R ⁴	物性値
8-1	MeS	H	CONHiBu	2,6-Et ₂ -3-Cl	mp179-183℃

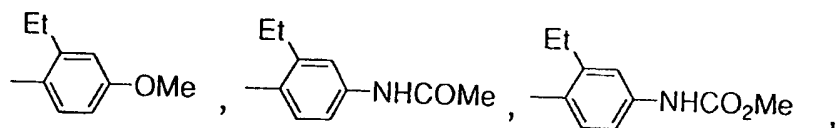
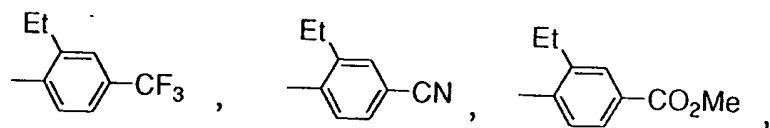
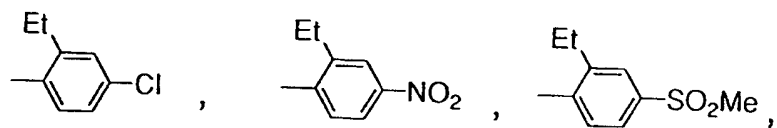
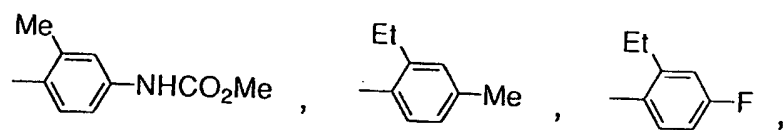
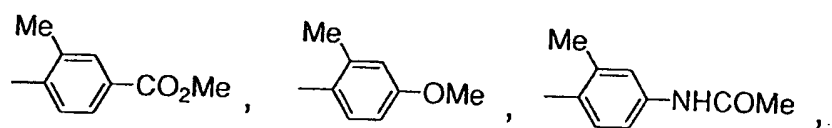
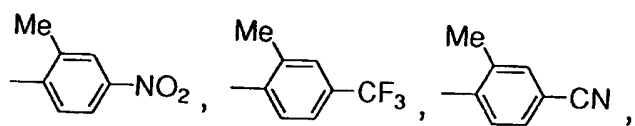
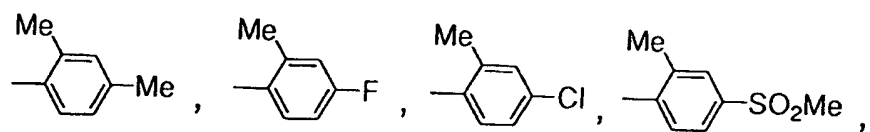
前記スキームあるいは実施例に準じて合成される本発明化合物群を、前記実施例で合成した化合物も含めて第9表～第14表に例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

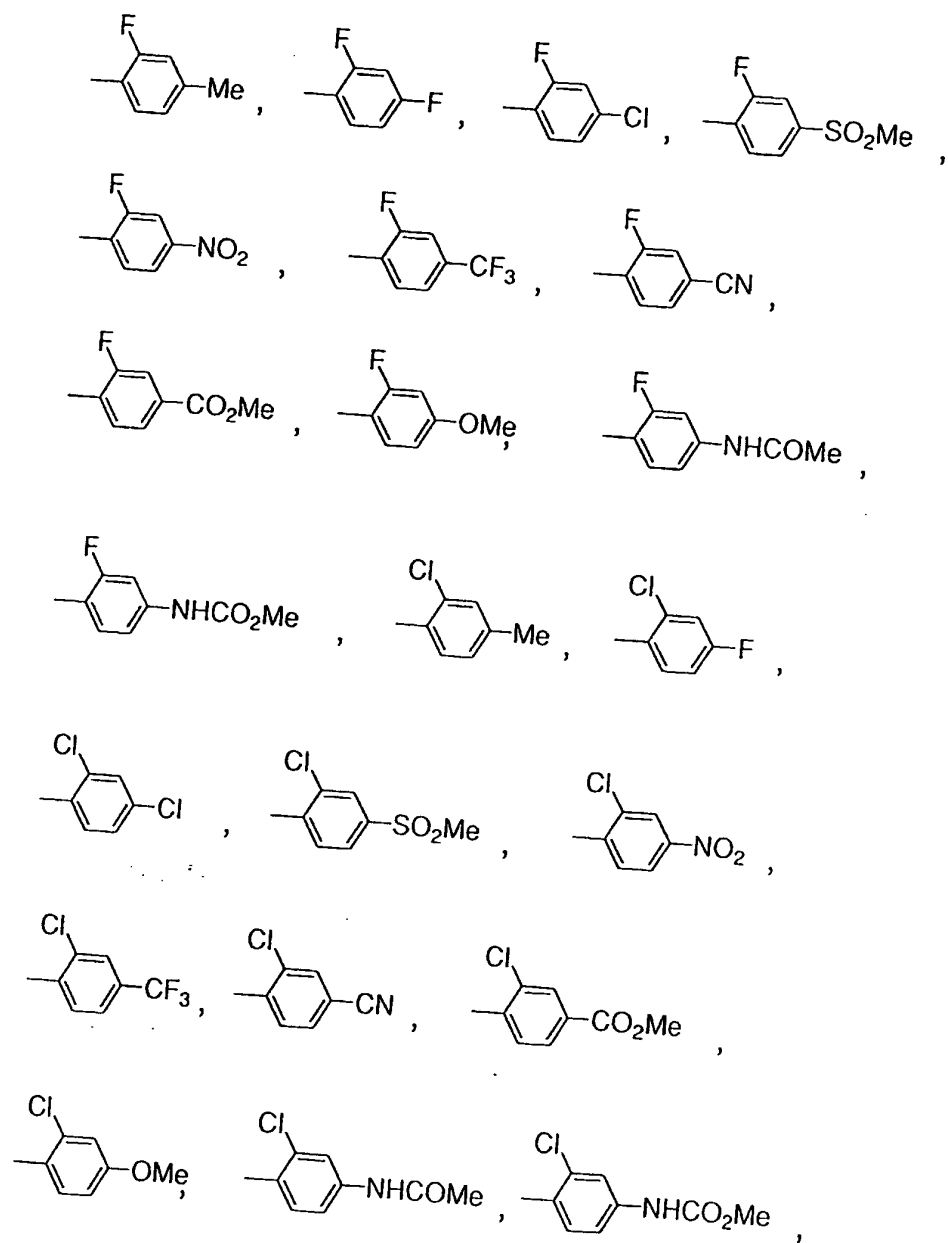
なお、第9表～第14表の表中、Ph (R⁴) は以下に示す構造を表わす。

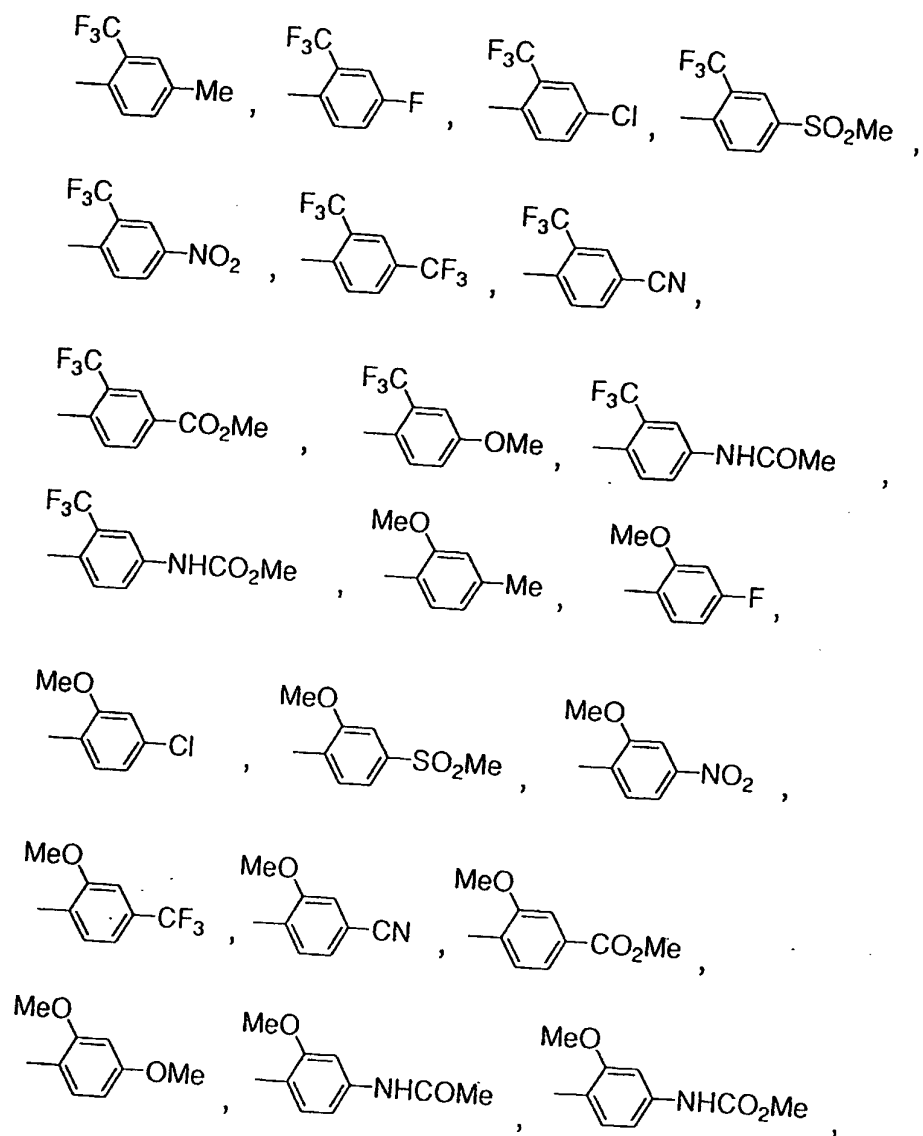


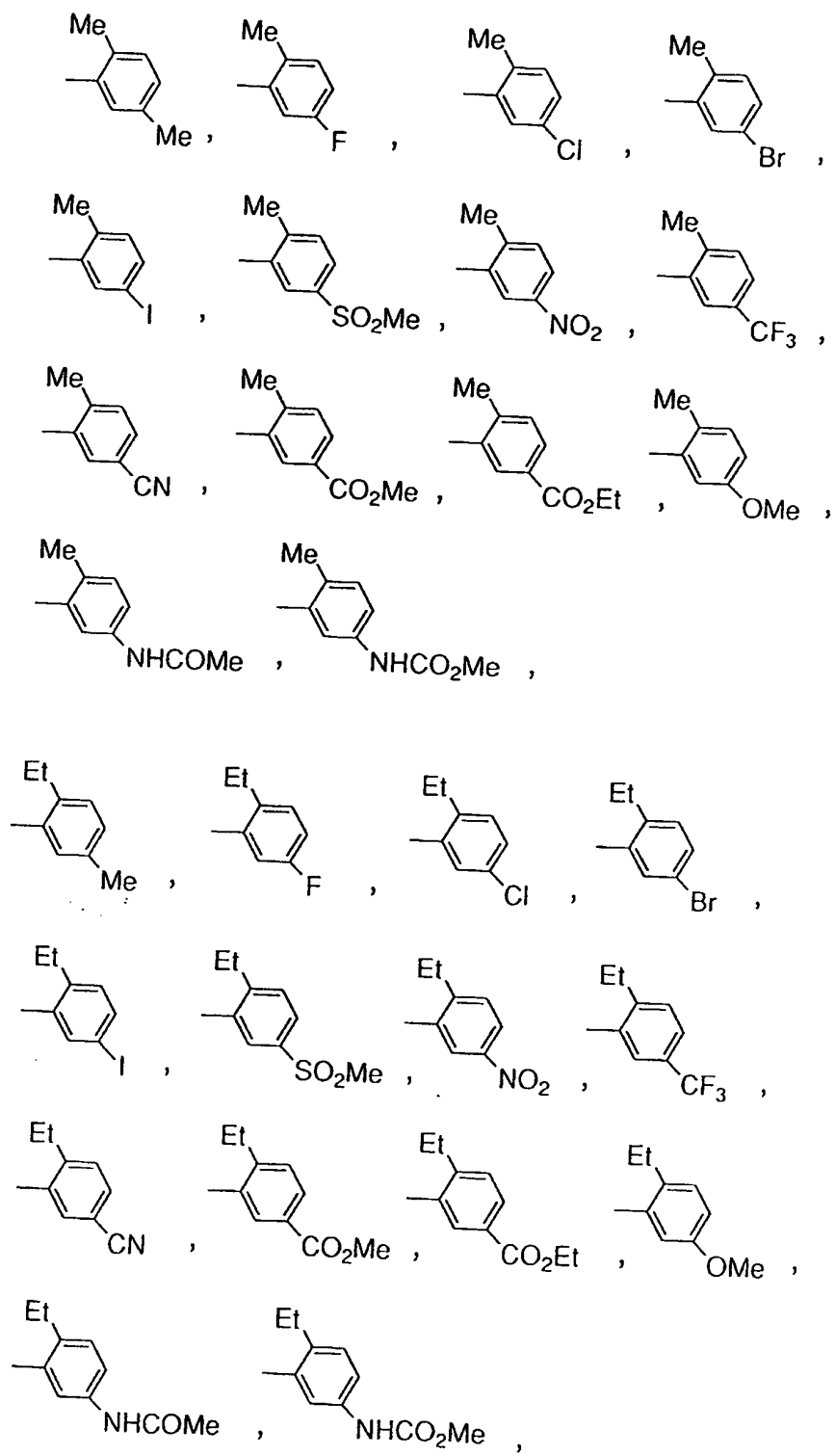


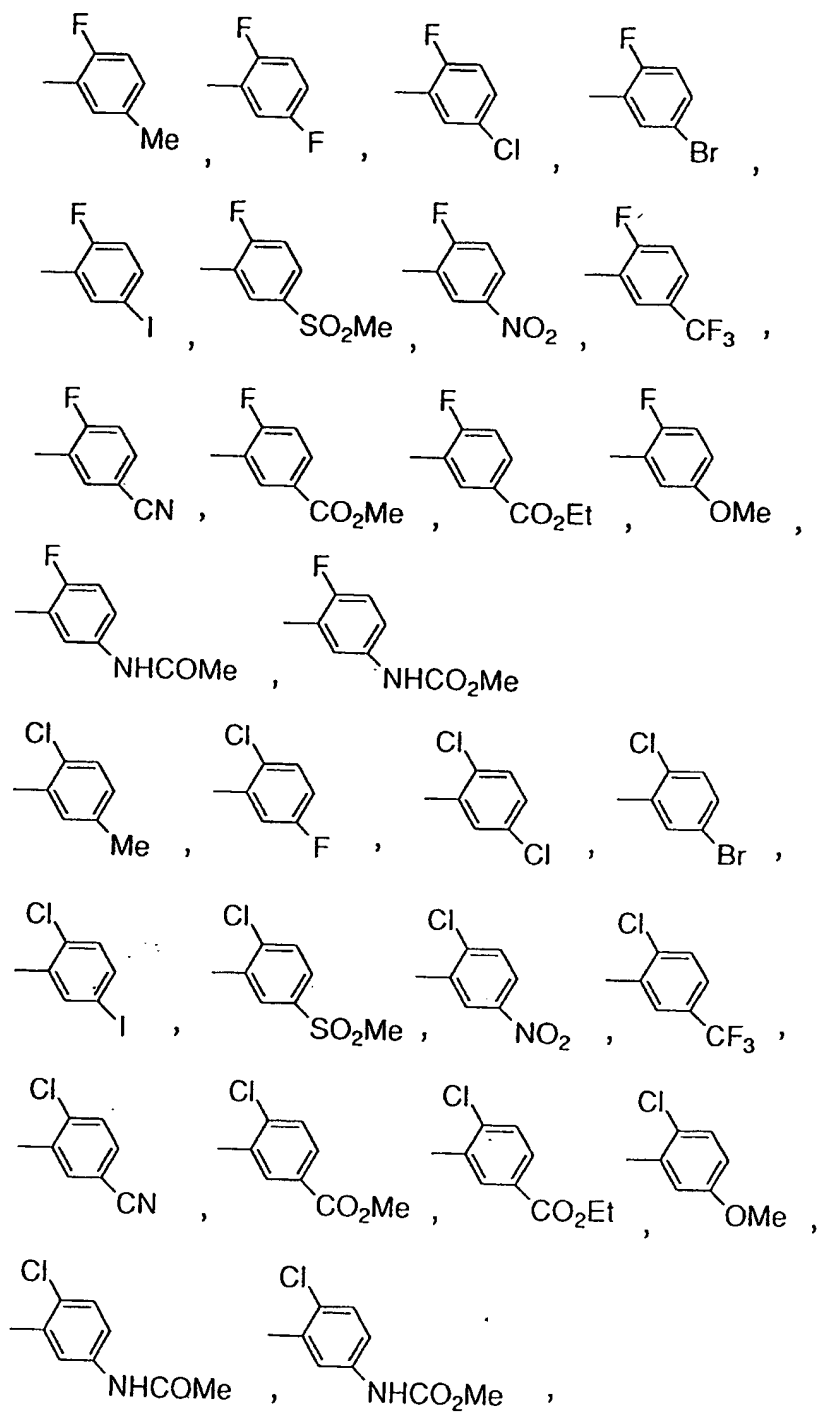


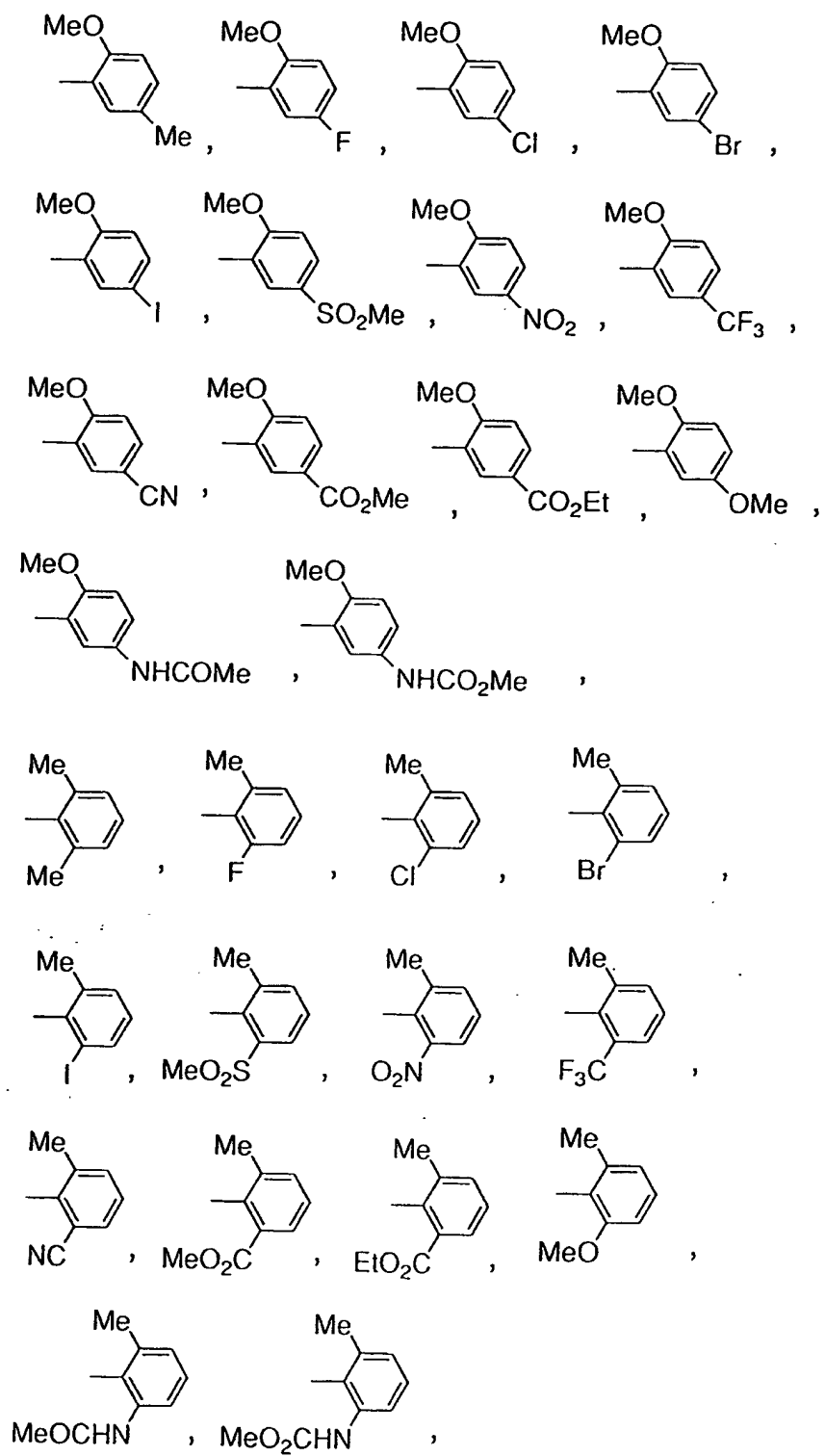


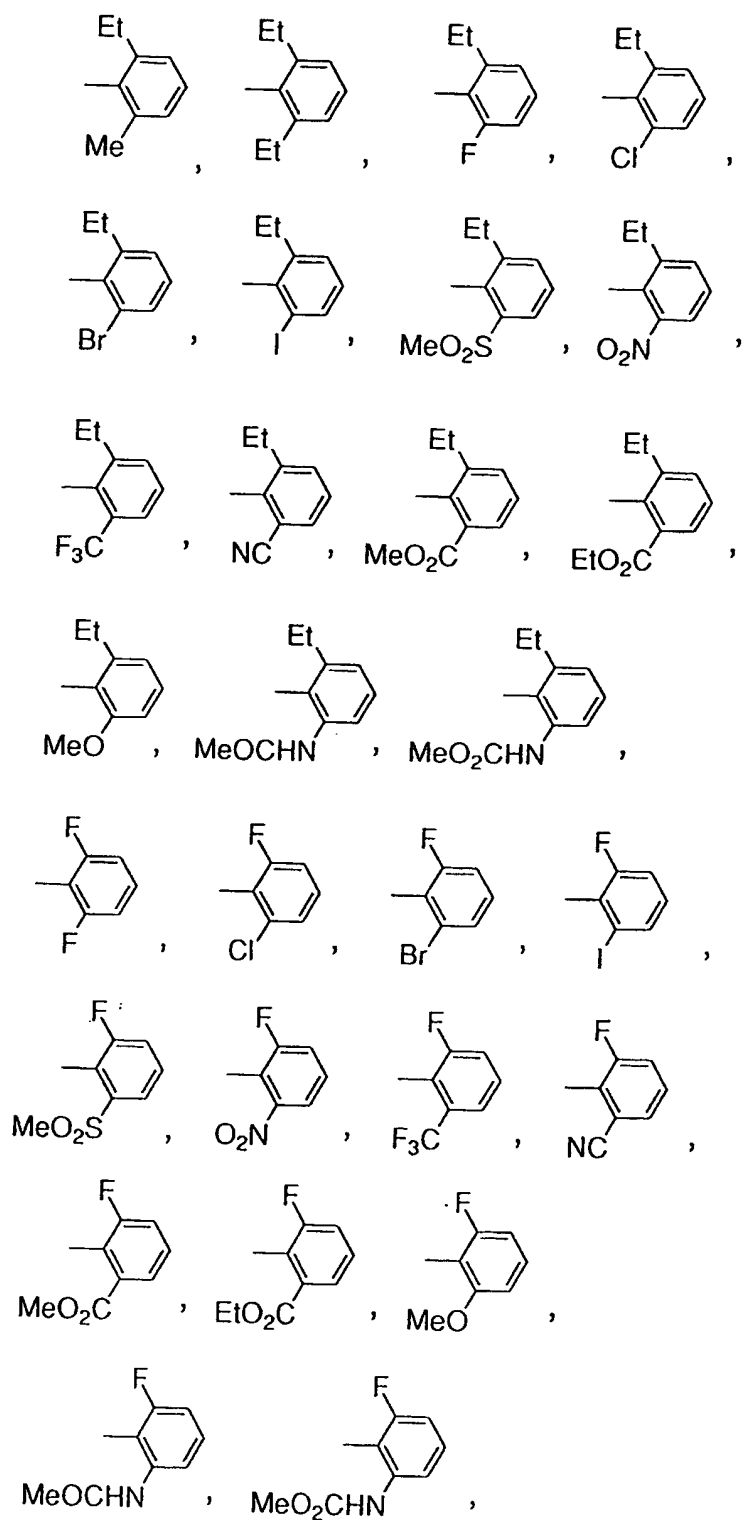


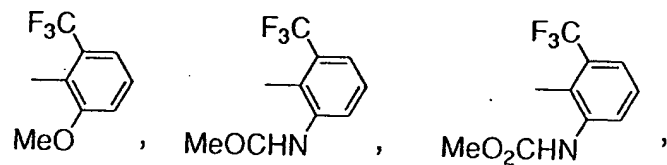
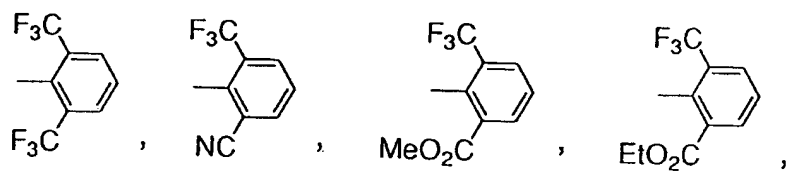
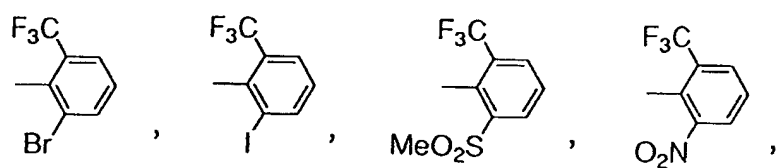
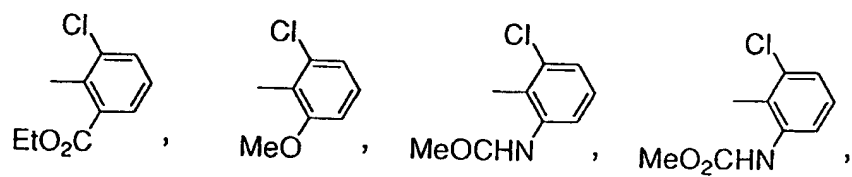
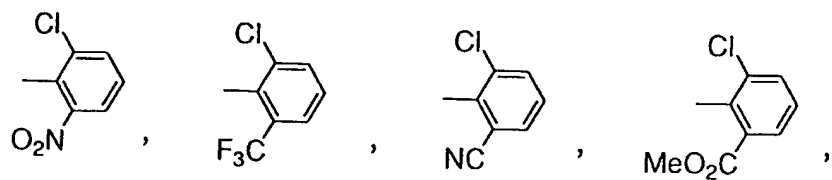
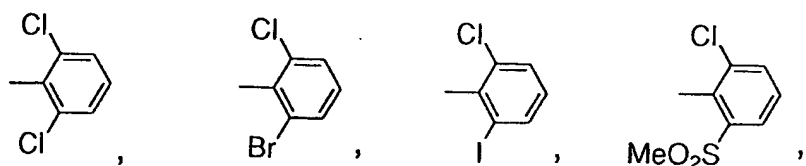


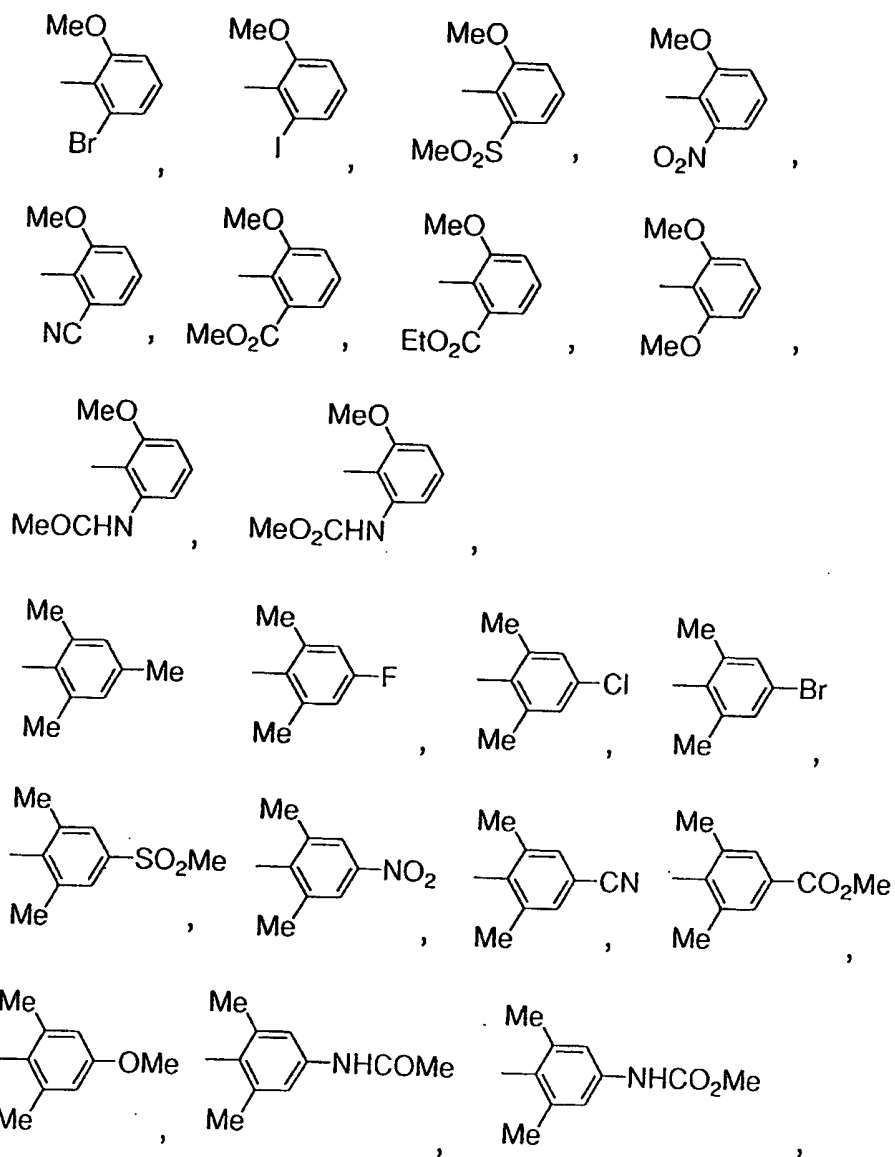


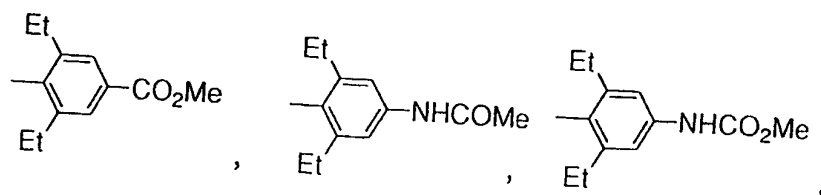
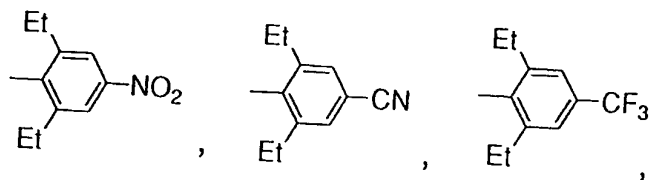
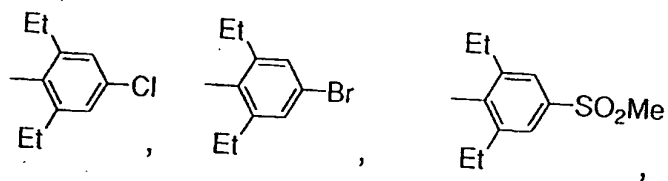
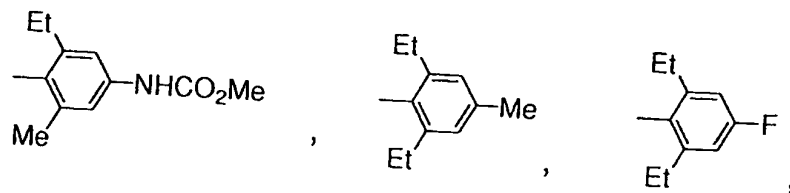
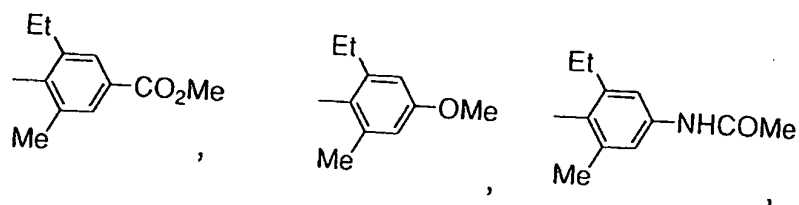
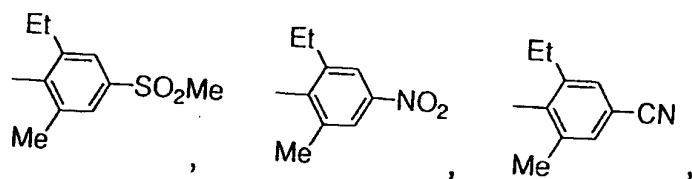
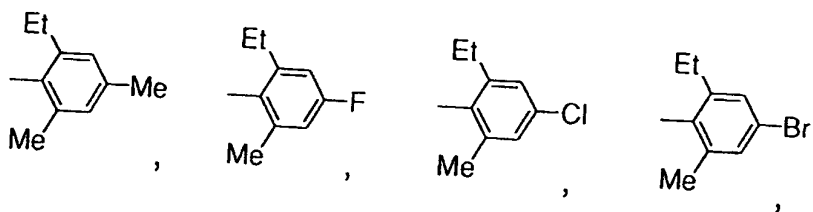


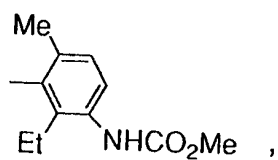
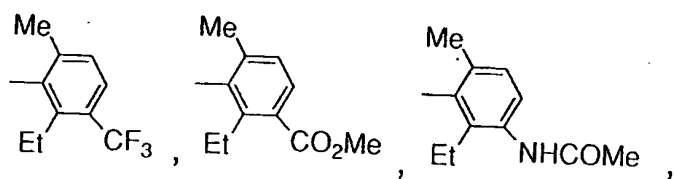
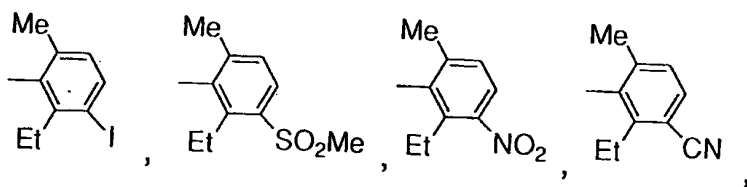
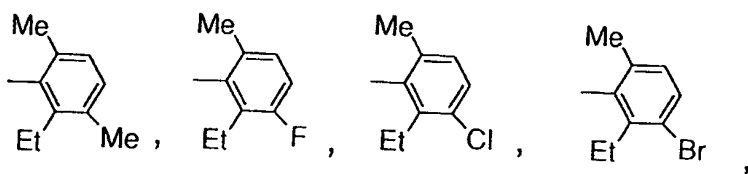
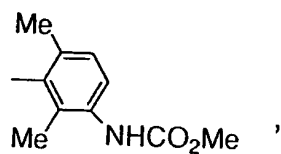
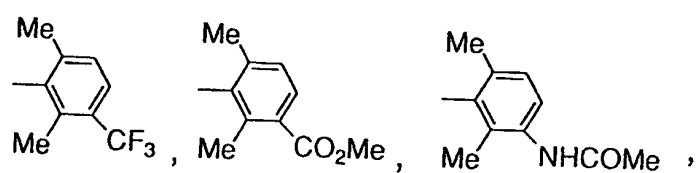
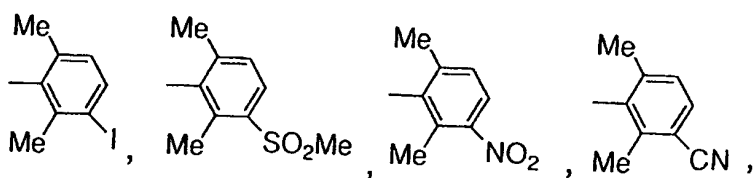
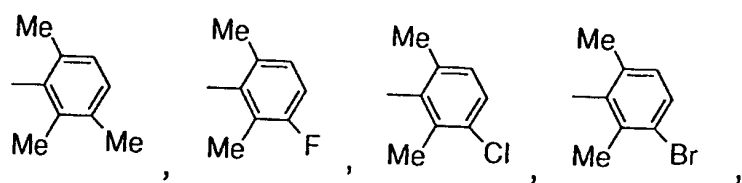


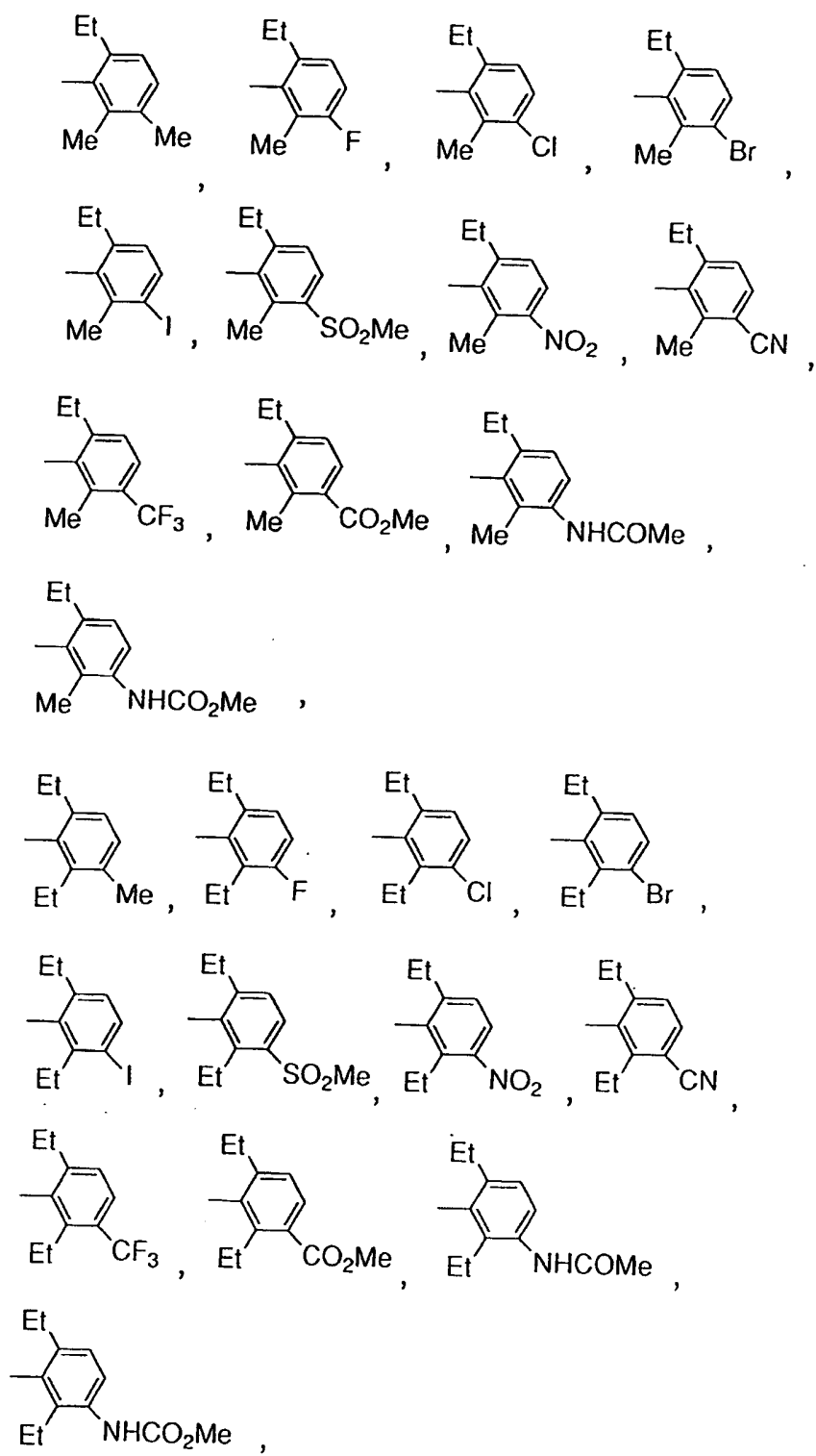


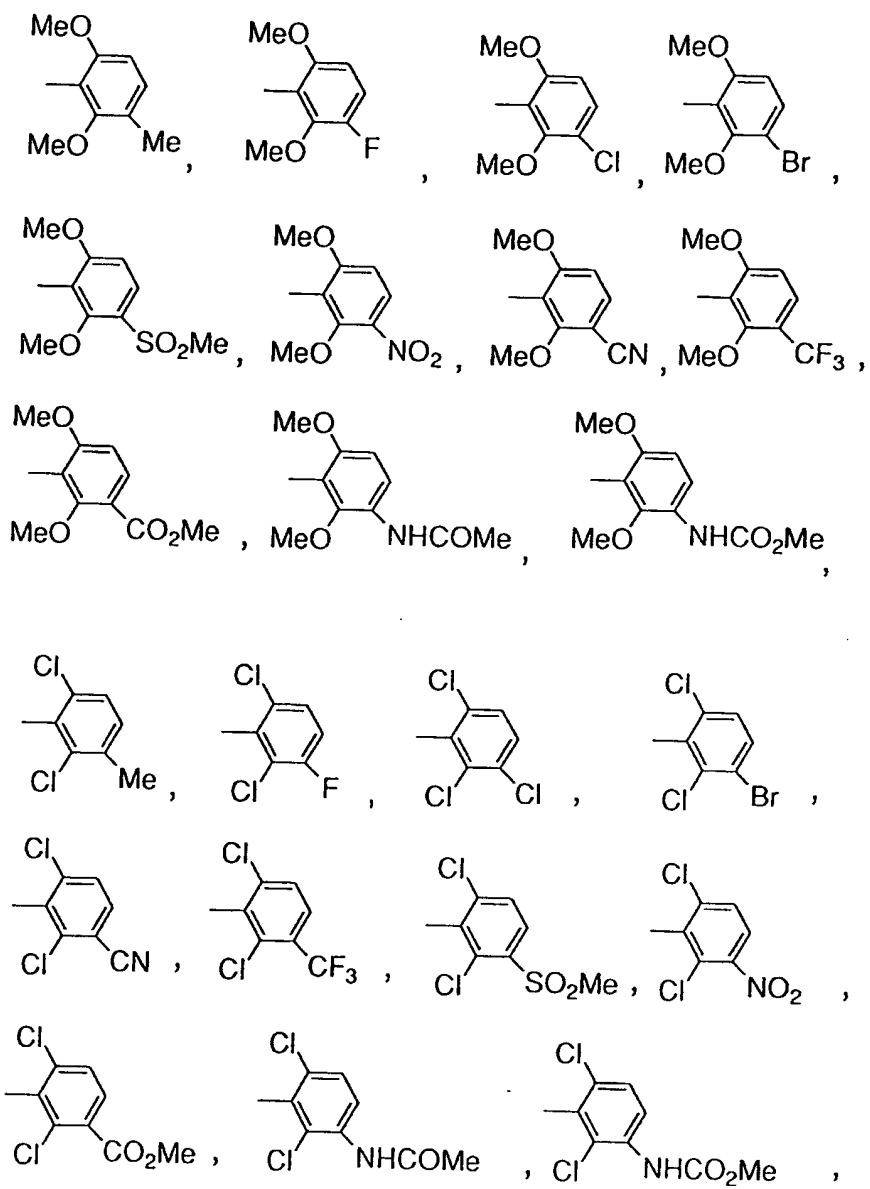


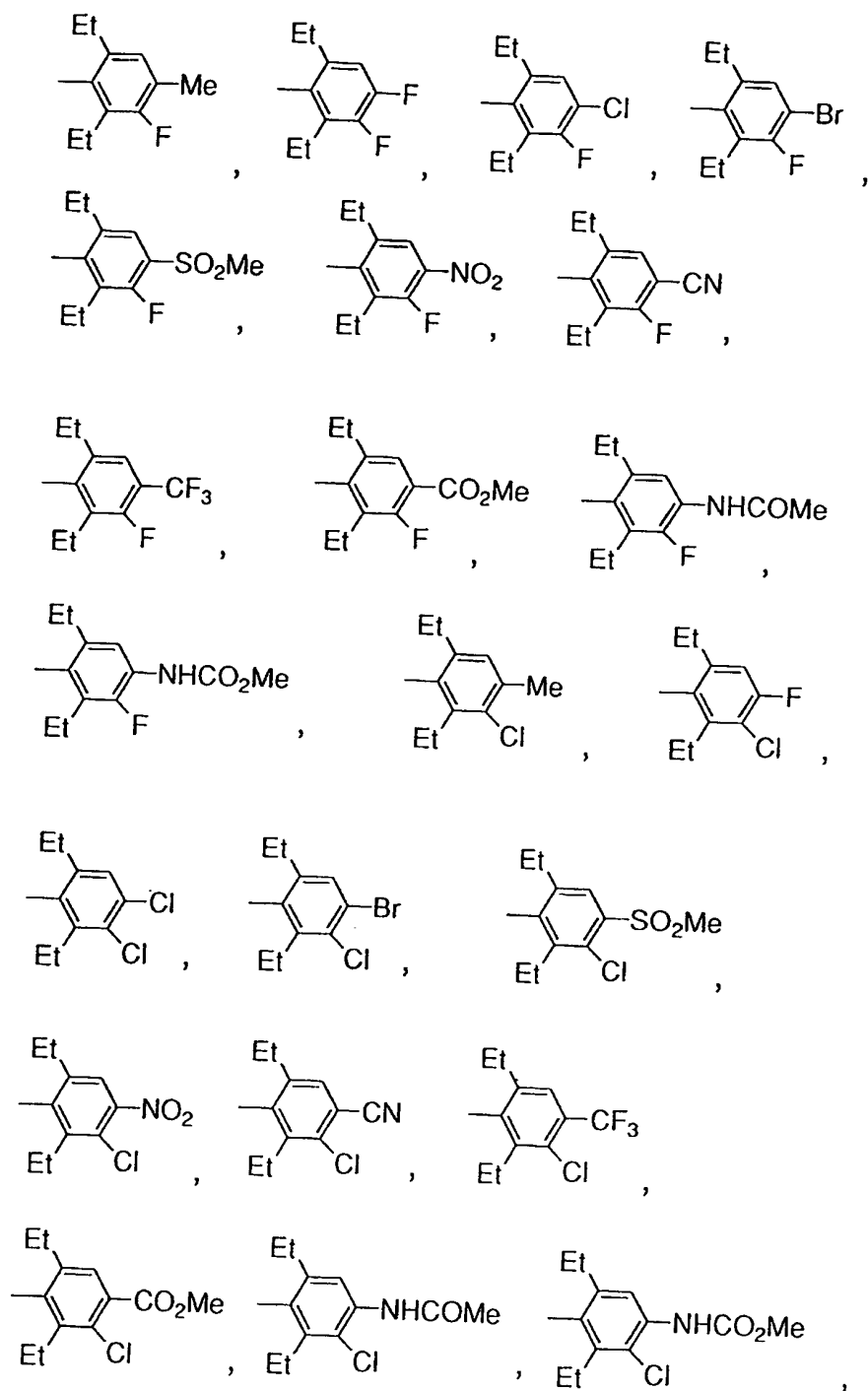


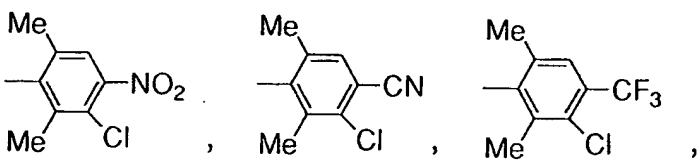
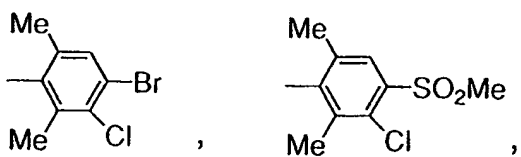
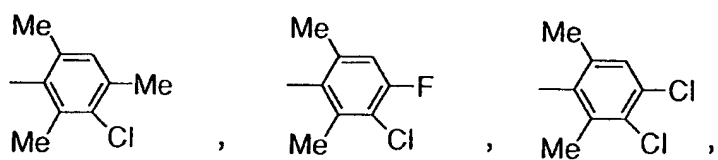
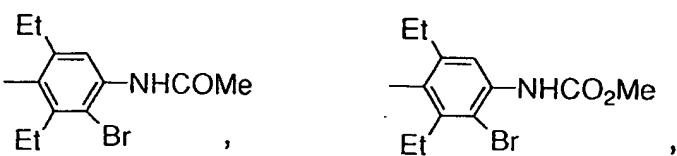
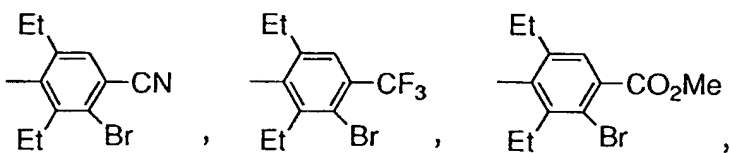
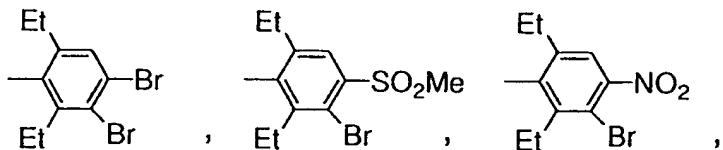
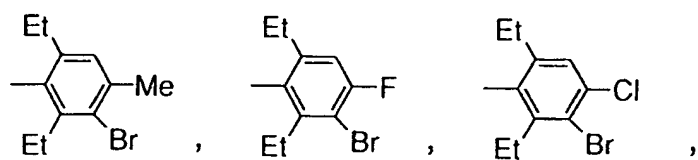


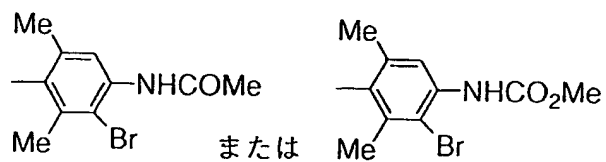
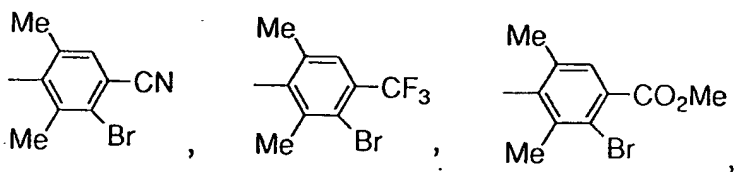
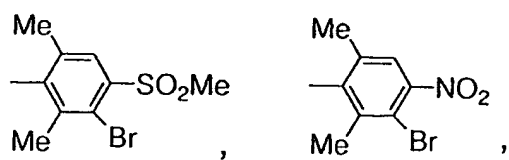
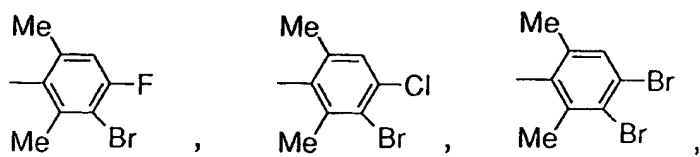
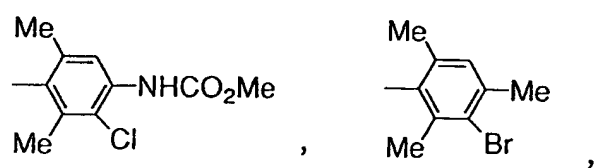
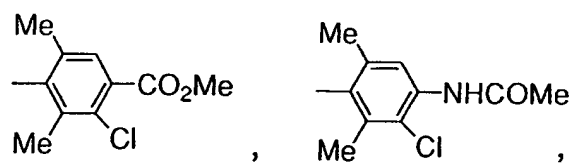












[第 9 表]

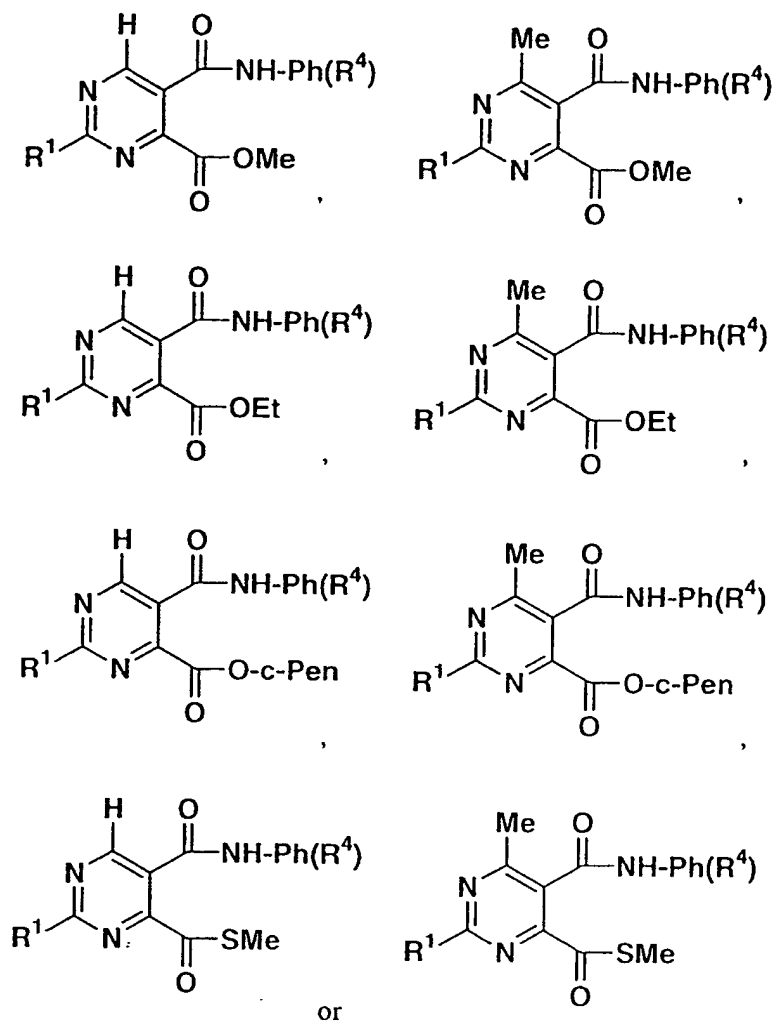


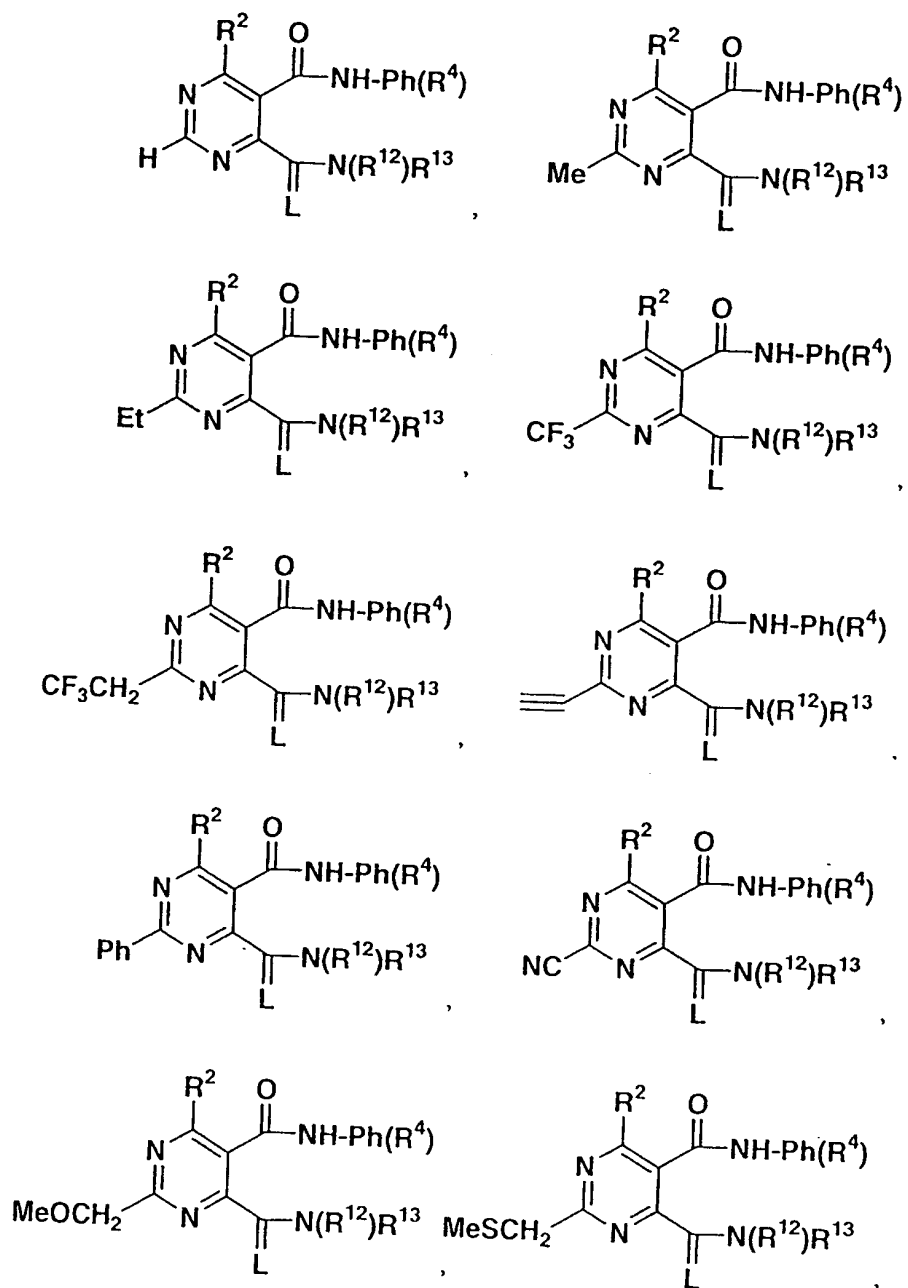
表 13

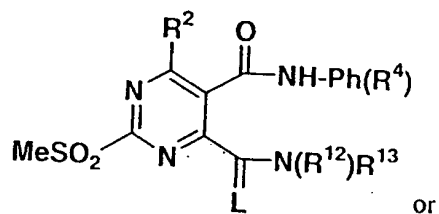
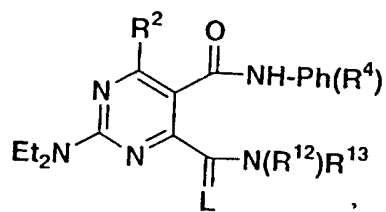
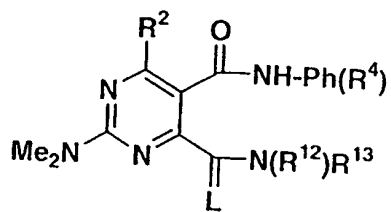
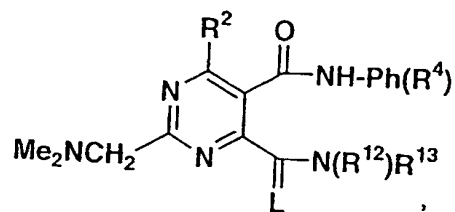
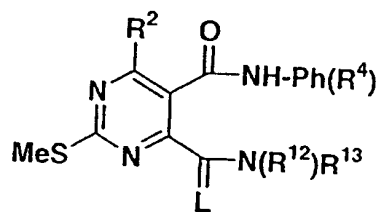
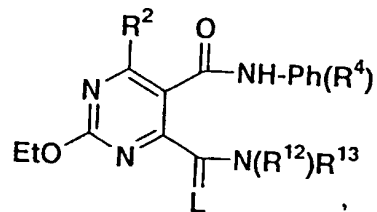
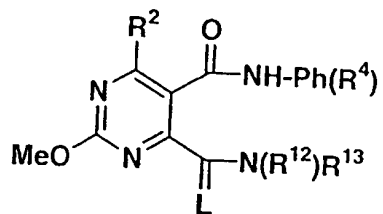
R¹

H、Me、Et、Pr、i-Pr、c-Pr、CF₃、MeSCH₂、CF₃CH₂、
MeOCH₂、Ph、Me₂NCH₂、F、Cl、Br、CN、MeSO₂、MeO、

EtO, CHF₂O, CF₃O, PhO, MeS, EtS, CHF₂S, CF₃S,
PhS, Me₂N, Et₂N, (CH₂)₄N, (CH₂)₅N

[第10表]





or

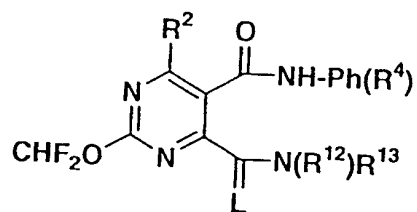


表 1 4

R^2	L	R^{12}	R^{13}
H	O	H	H
H	O	Me	H
H	O	Et	H
H	O	Pr	H
H	O	i-Pr	H
H	O	Bu	H
H	O	s-Bu	H
H	O	i-Bu	H
H	O	t-Bu	H
H	O	Pen	H
H	O	Hex	H
H	O	Hept	H
H	O	$CH_2CH=CH_2$	H
H	O	$CH_2C(Me)=CH_2$	H
H	O	$CH_2CH=CHMe$	H
H	O	$CH_2CH=CMe_2$	H
H	O	$CH(Me)CH=CH_2$	H
H	O	$C(Me)_2CH=CH_2$	H
H	O	$CH_2C\equiv CH$	H
H	O	$CH_2C\equiv CMe$	H
H	O	$CH(Me)C\equiv CH$	H
H	O	$C(Me)_2C\equiv CH$	H
H	O	$(CH_2)_2C\equiv CH$	H

表 15

R^2	L	R^{12}	R^{13}
H	O	CH_2CF_3	H
H	O	$(CH_2)_2Cl$	H
H	O	$(CH_2)_3Cl$	H
H	O	$(CH_2)_3Br$	H
H	O	$(CH_2)_3F$	H
H	O	$CH_2CH=CHCl$	H
H	O	$CH_2CH=CCl_2$	H
H	O	c-Pr	H
H	O	c-Bu	H
H	O	c-Pen	H
H	O	c-Hex	H
H	O	c-Hep	H
H	O	CH_2OH	H
H	O	$(CH_2)_2OH$	H
H	O	CH_2OMe	H
H	O	CH_2OEt	H
H	O	$(CH_2)_2OMe$	H
H	O	$(CH_2)_2OEt$	H
H	O	$(CH_2)_3OMe$	H
H	O	$(CH_2)_3OEt$	H
H	O	CH_2SMe	H
H	O	CN	H
H	O	Ph	H

表 1 6

R ²	L	R ¹²	R ¹³
H	O	CH ₂ Ph (4-OMe)	H
H	O	CH(Me)Ph	H
H	O	(CH ₂) ₂ Ph	H
H	O	CH=CHPh	H
H	O	CH ₂ CH=CHPh	H
H	O	C≡CPh	H
H	O	CH ₂ C≡CPh	H
H	O	G(a)	H
H	O	G(b)	H
H	O	G(c)	H
H	O	G(d)	H
H	O	Me	Me
H	O	Et	Me
H	O	Pr	Me
H	O	i-Pr	Me
H	O	Bu	Me
H	O	s-Bu	Me
H	O	i-Bu	Me
H	O	t-Bu	Me
H	O	Pen	Me
H	O	Hex	Me
H	O	Hep	Me

表 1 7

R^2	L	R^{12}	R^{13}
H	O	$CH_2CH=CH_2$	Me
H	O	$CH_2C(Me)=CH_2$	Me
H	O	$CH_2CH=CHMe$	Me
H	O	$CH_2CH=CMe_2$	Me
H	O	$CH(Me)CH=CH_2$	Me
H	O	$C(Me)_2CH=CH_2$	Me
H	O	$CH_2C\equiv CH$	Me
H	O	$CH_2C\equiv CMe$	Me
H	O	$CH(Me)C\equiv CH$	Me
H	O	$C(Me)_2C\equiv CH$	Me
H	O	$(CH_2)_2C\equiv CH$	Me
H	O	CH_2CF_3	Me
H	O	$(CH_2)_2Cl$	Me
H	O	$(CH_2)_3Cl$	Me
H	O	$(CH_2)_3Br$	Me
H	O	$(CH_2)_3F$	Me
H	O	$CH_2CH=CHCl$	Me
H	O	$CH_2CH=CCl_2$	Me
H	O	c-Pr	Me
H	O	c-Bu	Me
H	O	c-Pen	Me
H	O	c-Hex	Me
H	O	c-Hep	Me

表 18

R^2	L	R^{12}	R^{13}
H	O	CH_2OH	Me
H	O	$(CH_2)_2OH$	Me
H	O	CH_2OMe	Me
H	O	CH_2OEt	Me
H	O	$(CH_2)_2OMe$	Me
H	O	$(CH_2)_2OEt$	Me
H	O	$(CH_2)_3OMe$	Me
H	O	$(CH_2)_3OEt$	Me
H	O	CH_2SMe	Me
H	O	CN	Me
H	O	Ph	Me
H	O	$CH_2Ph(4-OMe)$	Me
H	O	$CH(Me)Ph$	Me
H	O	$(CH_2)_2Ph$	Me
H	O	$CH=CHPh$	Me
H	O	$CH_2CH=CHPh$	Me
H	O	$C\equiv CPh$	Me
H	O	$CH_2C\equiv CPh$	Me
H	O	G(a)	Me
H	O	G(b)	Me
H	O	G(c)	Me
H	O	G(d)	Me

表 19

R^2	L	R^{12}	R^{13}
H	O	Et	Et
H	O	Pr	Et
H	O	i-Pr	Et
H	O	Bu	Et
H	O	s-Bu	Et
H	O	i-Bu	Et
H	O	t-Bu	Et
H	O	Pen	Et
H	O	Hex	Et
H	O	Hept	Et
H	O	$CH_2CH=CH_2$	Et
H	O	$CH_2C(Me)=CH_2$	Et
H	O	$CH_2CH=CHMe$	Et
H	O	$CH_2CH=CM_e_2$	Et
H	O	$CH(Me)CH=CH_2$	Et
H	O	$C(Me)_2CH=CH_2$	Et
H	O	$CH_2C\equiv CH$	Et
H	O	$CH_2C\equiv CMe$	Et
H	O	$CH(Me)C\equiv CH$	Et
H	O	$C(Me)_2C\equiv CH$	Et
H	O	$(CH_2)_2C\equiv CH$	Et
H	O	CH_2CF_3	Et

表 20

R^2	L	R^{12}	R^{13}
H	O	$(CH_2)_2Cl$	Et
H	O	$(CH_2)_3Cl$	Et
H	O	$(CH_2)_3Br$	Et
H	O	$(CH_2)_3F$	Et
H	O	$CH_2CH=CHCl$	Et
H	O	$CH_2CH=CCl_2$	Et
H	O	c-Pr	Et
H	O	c-Bu	Et
H	O	c-Pen	Et
H	O	c-Hex	Et
H	O	c-Hep	Et
H	O	CH_2OH	Et
H	O	$(CH_2)_2OH$	Et
H	O	CH_2OMe	Et
H	O	CH_2OEt	Et
H	O	$(CH_2)_2OMe$	Et
H	O	$(CH_2)_2OEt$	Et
H	O	$(CH_2)_3OMe$	Et
H	O	$(CH_2)_3OEt$	Et
H	O	CH_2SMe	Et
H	O	CN	Et
H	O	Ph	Et
H	O	CH_2Ph (4-OMe)	Et

表 2 1

R^2	L	R^{12}	R^{13}
H	O	CH (Me) Ph	Et
H	O	(CH ₂) ₂ Ph	Et
H	O	CH=CHPh	Et
H	O	CH ₂ CH=CHPh	Et
H	O	C≡CPh	Et
H	O	CH ₂ C≡CPh	Et
H	O	G (a)	Et
H	O	G (b)	Et
H	O	G (c)	Et
H	O	G (d)	Et
H	O	Pr	CH ₂ CH=CH ₂
H	O	i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂
H	O	Bu	CH ₂ CH=CH ₂
H	O	s-Bu	CH ₂ CH=CH ₂
H	O	i-Bu	CH ₂ CH=CH ₂
H	O	t-Bu	CH ₂ CH=CH ₂
H	O	Pen	CH ₂ CH=CH ₂
H	O	Hex	CH ₂ CH=CH ₂
H	O	Hept	CH ₂ CH=CH ₂
H	O	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂

表 2 2

R^2	L	R^{12}	R^{13}
H	O	$CH_2C(Me)=CH_2$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$CH_2CH=CHMe$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$CH_2CH=CHMe_2$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$CH(Me)CH=CH_2$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$C(Me)_2CH=CH_2$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$CH_2C\equiv CH$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$CH_2C\equiv CMe$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$CH(Me)C\equiv CH$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$C(Me)_2C\equiv CH$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$(CH_2)_2C\equiv CH$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	CH_2CF_3	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$(CH_2)_2Cl$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$(CH_2)_3Cl$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$(CH_2)_3Br$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$(CH_2)_3F$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$CH_2CH=CHCl$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$CH_2CH=CCl_2$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	c-Pr	$CH_2CH=CH_2$
H	O	c-Bu	$CH_2CH=CH_2$
H	O	c-Pen	$CH_2CH=CH_2$
H	O	c-Hex	$CH_2CH=CH_2$
H	O	c-Hep	$CH_2CH=CH_2$
H	O	CH_2OH	$CH_2CH=CH_2$

表 2 3

R^2	L	R^{12}	R^{13}
H	O	$(CH_2)_2OH$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	CH_2OMe	$CH_2CH=CH_2$
H	O	CH_2OEt	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$(CH_2)_2OMe$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$(CH_2)_2OEt$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$(CH_2)_3OMe$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$(CH_2)_3OEt$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	CH_2SMe	$CH_2CH=CH_2$
H	O	CN	$CH_2CH=CH_2$
H	O	Ph	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$CH_2Ph(4-OMe)$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$CH(Me)Ph$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$(CH_2)_2Ph$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$CH=CHPh$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$CH_2CH=CHPh$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$C\equiv CPh$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	$CH_2C\equiv CPh$	$CH_2CH=CH_2$
H	O	G(a)	$CH_2CH=CH_2$
H	O	G(b)	$CH_2CH=CH_2$
H	O	G(c)	$CH_2CH=CH_2$
H	O	G(d)	$CH_2CH=CH_2$
H	O	H	COMe
H	O	Me	COMe

表 2 4

R^2	L	R^{12}	R^{13}
H	O	E t	C O M e
H	O	P r	C O M e
H	O	i - P r	C O M e
H	O	B u	C O M e
H	O	s - B u	C O M e
H	O	i - B u	C O M e
H	O	t - B u	C O M e
H	O	P e n	C O M e
H	O	H e x	C O M e
H	O	H e p	C O M e
H	O	$CH_2CH=CH_2$	C O M e
H	O	$CH_2C(Me)=CH_2$	C O M e
H	O	$CH_2CH=CHMe$	C O M e
H	O	$CH_2CH=CM e_2$	C O M e
H	O	$CH(Me)CH=CH_2$	C O M e
H	O	$C(Me)_2CH=CH_2$	C O M e
H	O	$CH_2C\equiv CH$	C O M e
H	O	$CH_2C\equiv CMe$	C O M e
H	O	$CH(Me)C\equiv CH$	C O M e
H	O	$C(Me)_2C\equiv CH$	C O M e
H	O	$(CH_2)_2C\equiv CH$	C O M e
H	O	CH_2CF_3	C O M e
H	O	$(CH_2)_2Cl$	C O M e

表 2 5

R ²	L	R ¹²	R ¹³
H	O	(CH ₂) ₃ Cl	COMe
H	O	(CH ₂) ₃ Br	COMe
H	O	(CH ₂) ₃ F	COMe
H	O	CH ₂ CH=CHCl	COMe
H	O	CH ₂ CH=CCl ₂	COMe
H	O	c-Pr	COMe
H	O	c-Bu	COMe
H	O	c-Pen	COMe
H	O	c-Hex	COMe
H	O	c-Hep	COMe
H	O	CH ₂ OH	COMe
H	O	(CH ₂) ₂ OH	COMe
H	O	CH ₂ OMe	COMe
H	O	CH ₂ OEt	COMe
H	O	(CH ₂) ₂ OMe	COMe
H	O	(CH ₂) ₂ OEt	COMe
H	O	(CH ₂) ₃ OMe	COMe
H	O	(CH ₂) ₃ OEt	COMe
H	O	CH ₂ SMe	COMe
H	O	CN	COMe
H	O	Ph	COMe
H	O	CH ₂ Ph (4-OMe)	COMe
H	O	CH(Me)Ph	COMe

表 2 6

R^2	L	R^{12}	R^{13}
H	O	$(CH_2)_2Ph$	COMe
H	O	$CH=CHPh$	COMe
H	O	$CH_2CH=CHPh$	COMe
H	O	$C\equiv CPh$	COMe
H	O	$CH_2C\equiv CPh$	COMe
H	O	G (a)	COMe
H	O	G (b)	COMe
H	O	G (c)	COMe
H	O	G (d)	COMe
H	O	H	CO-t-Bu
H	O	Me	CO-t-Bu
H	O	Et	CO-t-Bu
H	O	Pr	CO-t-Bu
H	O	i-Pr	CO-t-Bu
H	O	Bu	CO-t-Bu
H	O	s-Bu	CO-t-Bu
H	O	i-Bu	CO-t-Bu
H	O	t-Bu	CO-t-Bu
H	O	Pen	CO-t-Bu
H	O	Hex	CO-t-Bu
H	O	Hep	CO-t-Bu
H	O	$CH_2CH=CH_2$	CO-t-Bu
H	O	$CH_2C(Me)=CH_2$	CO-t-Bu

表 2 7

R^2	L	R^{12}	R^{13}
H	O	$CH_2CH=CHMe$	$CO-t-Bu$
H	O	$CH_2CH=CM e_2$	$CO-t-Bu$
H	O	$CH(Me)CH=CH_2$	$CO-t-Bu$
H	O	$C(Me)_2CH=CH_2$	$CO-t-Bu$
H	O	$CH_2C\equiv CH$	$CO-t-Bu$
H	O	$CH_2C\equiv CMe$	$CO-t-Bu$
H	O	$CH(Me)C\equiv CH$	$CO-t-Bu$
H	O	$C(Me)_2C\equiv CH$	$CO-t-Bu$
H	O	$(CH_2)_2C\equiv CH$	$CO-t-Bu$
H	O	CH_2CF_3	$CO-t-Bu$
H	O	$(CH_2)_2Cl$	$CO-t-Bu$
H	O	$(CH_2)_3Cl$	$CO-t-Bu$
H	O	$(CH_2)_3Br$	$CO-t-Bu$
H	O	$(CH_2)_3F$	$CO-t-Bu$
H	O	$CH_2CH=CHCl$	$CO-t-Bu$
H	O	$CH_2CH=CCl_2$	$CO-t-Bu$
H	O	$c-Pr$	$CO-t-Bu$
H	O	$c-Bu$	$CO-t-Bu$
H	O	$c-Pen$	$CO-t-Bu$
H	O	$c-Hex$	$CO-t-Bu$
H	O	$c-Hep$	$CO-t-Bu$
H	O	CH_2OH	$CO-t-Bu$
H	O	$(CH_2)_2OH$	$CO-t-Bu$

表 2 8

R ²	L	R ¹²	R ¹³
H	O	CH ₂ OMe	CO-t-Bu
H	O	CH ₂ OEt	CO-t-Bu
H	O	(CH ₂) ₂ OMe	CO-t-Bu
H	O	(CH ₂) ₂ OEt	CO-t-Bu
H	O	(CH ₂) ₃ OMe	CO-t-Bu
H	O	(CH ₂) ₃ OEt	CO-t-Bu
H	O	CH ₂ SMe	CO-t-Bu
H	O	CN	CO-t-Bu
H	O	Ph	CO-t-Bu
H	O	CH ₂ Ph (4-OMe)	CO-t-Bu
H	O	CH(Me)Ph	CO-t-Bu
H	O	(CH ₂) ₂ Ph	CO-t-Bu
H	O	CH=CHPh	CO-t-Bu
H	O	CH ₂ CH=CHPh	CO-t-Bu
H	O	C≡CPh	CO-t-Bu
H	O	CH ₂ C≡CPh	CO-t-Bu
H	O	G(a)	CO-t-Bu
H	O	G(b)	CO-t-Bu
H	O	G(c)	CO-t-Bu
H	O	G(d)	CO-t-Bu
H	O	H	COPh (4-OMe)
H	O	Me	COPh (4-OMe)
H	O	Et	COPh (4-OMe)

表 2 9

R ²	L	R ¹²	R ¹³
H	O	Pr	COPh (4-OMe)
H	O	i-Pr	COPh (4-OMe)
H	O	Bu	COPh (4-OMe)
H	O	s-Bu	COPh (4-OMe)
H	O	i-Bu	COPh (4-OMe)
H	O	t-Bu	COPh (4-OMe)
H	O	Pen	COPh (4-OMe)
H	O	Hex	COPh (4-OMe)
H	O	Hept	COPh (4-OMe)
H	O	CH ₂ CH=CH ₂	COPh (4-OMe)
H	O	CH ₂ C(Me)=CH ₂	COPh (4-OMe)
H	O	CH ₂ CH=CHMe	COPh (4-OMe)
H	O	CH ₂ CH=CMe ₂	COPh (4-OMe)
H	O	CH(Me)CH=CH ₂	COPh (4-OMe)
H	O	C(Me) ₂ CH=CH ₂	COPh (4-OMe)
H	O	CH ₂ C≡CH	COPh (4-OMe)
H	O	CH ₂ C≡CMe	COPh (4-OMe)
H	O	CH(Me)C≡CH	COPh (4-OMe)
H	O	C(Me) ₂ C≡CH	COPh (4-OMe)
H	O	(CH ₂) ₂ C≡CH	COPh (4-OMe)
H	O	CH ₂ CF ₃	COPh (4-OMe)
H	O	(CH ₂) ₂ Cl	COPh (4-OMe)
H	O	(CH ₂) ₃ Cl	COPh (4-OMe)

表 3 0

R ²	L	R ¹²	R ¹³
H	O	(CH ₂) ₃ Br	COPh (4-OMe)
H	O	(CH ₂) ₃ F	COPh (4-OMe)
H	O	CH ₂ CH=CHCl	COPh (4-OMe)
H	O	CH ₂ CH=CCl ₂	COPh (4-OMe)
H	O	c-Pr	COPh (4-OMe)
H	O	c-Bu	COPh (4-OMe)
H	O	c-Pen	COPh (4-OMe)
H	O	c-Hex	COPh (4-OMe)
H	O	c-Hep	COPh (4-OMe)
H	O	CH ₂ OH	COPh (4-OMe)
H	O	(CH ₂) ₂ OH	COPh (4-OMe)
H	O	CH ₂ OMe	COPh (4-OMe)
H	O	CH ₂ OEt	COPh (4-OMe)
H	O	(CH ₂) ₂ OMe	COPh (4-OMe)
H	O	(CH ₂) ₂ OEt	COPh (4-OMe)
H	O	(CH ₂) ₃ OMe	COPh (4-OMe)
H	O	(CH ₂) ₃ OEt	COPh (4-OMe)
H	O	CH ₂ SMe	COPh (4-OMe)
H	O	CN	COPh (4-OMe)
H	O	Ph	COPh (4-OMe)
H	O	CH ₂ Ph (4-OMe)	COPh (4-OMe)
H	O	CH(Me)Ph	COPh (4-OMe)
H	O	(CH ₂) ₂ Ph	COPh (4-OMe)

表 3 1

R^2	L	R^{12}	R^{13}
H	O	$CH=CHPh$	$COPh(4-OMe)$
H	O	$CH_2CH=CHPh$	$COPh(4-OMe)$
H	O	$C\equiv CPh$	$COPh(4-OMe)$
H	O	$CH_2C\equiv CPh$	$COPh(4-OMe)$
H	O	G (a)	$COPh(4-OMe)$
H	O	G (b)	$COPh(4-OMe)$
H	O	G (c)	$COPh(4-OMe)$
H	O	G (d)	$COPh(4-OMe)$
H	O	H	CO_2Me
H	O	Me	CO_2Me
H	O	Et	CO_2Me
H	O	Pr	CO_2Me
H	O	i-Pr	CO_2Me
H	O	Bu	CO_2Me
H	O	s-Bu	CO_2Me
H	O	i-Bu	CO_2Me
H	O	t-Bu	CO_2Me
H	O	Pen	CO_2Me
H	O	Hex	CO_2Me
H	O	Hept	CO_2Me
H	O	$CH_2CH=CH_2$	CO_2Me
H	O	$CH_2C(Me)=CH_2$	CO_2Me
H	O	$CH_2CH=CHMe$	CO_2Me

表 3 2

R^2	L	R^{12}	R^{13}
H	O	$CH_2CH=CHMe_2$	CO_2Me
H	O	$CH(Me)CH=CH_2$	CO_2Me
H	O	$C(Me)_2CH=CH_2$	CO_2Me
H	O	$CH_2C\equiv CH$	CO_2Me
H	O	$CH_2C\equiv CMe$	CO_2Me
H	O	$CH(Me)C\equiv CH$	CO_2Me
H	O	$C(Me)_2C\equiv CH$	CO_2Me
H	O	$(CH_2)_2C\equiv CH$	CO_2Me
H	O	CH_2CF_3	CO_2Me
H	O	$(CH_2)_2Cl$	CO_2Me
H	O	$(CH_2)_3Cl$	CO_2Me
H	O	$(CH_2)_3Br$	CO_2Me
H	O	$(CH_2)_3F$	CO_2Me
H	O	$CH_2CH=CHCl$	CO_2Me
H	O	$CH_2CH=CCl_2$	CO_2Me
H	O	c-Pr	CO_2Me
H	O	c-Bu	CO_2Me
H	O	c-Pen	CO_2Me
H	O	c-Hex	CO_2Me
H	O	c-Hep	CO_2Me
H	O	CH_2OH	CO_2Me
H	O	$(CH_2)_2OH$	CO_2Me
H	O	CH_2OMe	CO_2Me

表 3 3

R ²	L	R ¹²	R ¹³
H	O	CH ₂ OE t	CO ₂ Me
H	O	(CH ₂) ₂ OMe	CO ₂ Me
H	O	(CH ₂) ₂ OE t	CO ₂ Me
H	O	(CH ₂) ₃ OMe	CO ₂ Me
H	O	(CH ₂) ₃ OE t	CO ₂ Me
H	O	CH ₂ SMe	CO ₂ Me
H	O	CN	CO ₂ Me
H	O	Ph	CO ₂ Me
H	O	CH ₂ Ph (4-OMe)	CO ₂ Me
H	O	CH(Me)Ph	CO ₂ Me
H	O	(CH ₂) ₂ Ph	CO ₂ Me
H	O	CH=CHPh	CO ₂ Me
H	O	CH ₂ CH=CHPh	CO ₂ Me
H	O	C≡CPh	CO ₂ Me
H	O	CH ₂ C≡CPh	CO ₂ Me
H	O	G(a)	CO ₂ Me
H	O	G(b)	CO ₂ Me
H	O	G(c)	CO ₂ Me
H	O	G(d)	CO ₂ Me
H	O	H	SO ₂ Me
H	O	Me	SO ₂ Me
H	O	Et	SO ₂ Me
H	O	Pr	SO ₂ Me

表 3 4

R ²	L	R ¹²	R ¹³
H	O	i - P r	S O ₂ M e
H	O	B u	S O ₂ M e
H	O	s - B u	S O ₂ M e
H	O	i - B u	S O ₂ M e
H	O	t - B u	S O ₂ M e
H	O	P e n	S O ₂ M e
H	O	H e x	S O ₂ M e
H	O	H e p	S O ₂ M e
H	O	C H ₂ C H = C H ₂	S O ₂ M e
H	O	C H ₂ C (M e) = C H ₂	S O ₂ M e
H	O	C H ₂ C H = C H M e	S O ₂ M e
H	O	C H ₂ C H = C M e ₂	S O ₂ M e
H	O	C H (M e) C H = C H ₂	S O ₂ M e
H	O	C (M e) ₂ C H = C H ₂	S O ₂ M e
H	O	C H ₂ C ≡ C H	S O ₂ M e
H	O	C H ₂ C ≡ C M e	S O ₂ M e
H	O	C H (M e) C ≡ C H	S O ₂ M e
H	O	C (M e) ₂ C ≡ C H	S O ₂ M e
H	O	(C H ₂) ₂ C ≡ C H	S O ₂ M e
H	O	C H ₂ C F ₃	S O ₂ M e
H	O	(C H ₂) ₂ C l	S O ₂ M e
H	O	(C H ₂) ₃ C l	S O ₂ M e
H	O	(C H ₂) ₃ B r	S O ₂ M e

表 3 5

R ²	L	R ¹²	R ¹³
H	O	(CH ₂) ₃ F	SO ₂ Me
H	O	CH ₂ CH=CHCl	SO ₂ Me
H	O	CH ₂ CH=CCl ₂	SO ₂ Me
H	O	c-Pr	SO ₂ Me
H	O	c-Bu	SO ₂ Me
H	O	c-Pen	SO ₂ Me
H	O	c-Hex	SO ₂ Me
H	O	c-Hep	SO ₂ Me
H	O	CH ₂ OH	SO ₂ Me
H	O	(CH ₂) ₂ OH	SO ₂ Me
H	O	CH ₂ OMe	SO ₂ Me
H	O	CH ₂ OEt	SO ₂ Me
H	O	(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
H	O	(CH ₂) ₂ OEt	SO ₂ Me
H	O	(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
H	O	(CH ₂) ₃ OEt	SO ₂ Me
H	O	CH ₂ SMe	SO ₂ Me
H	O	CN	SO ₂ Me
H	O	Ph	SO ₂ Me
H	O	CH ₂ Ph (4-OMe)	SO ₂ Me
H	O	CH(Me)Ph	SO ₂ Me
H	O	(CH ₂) ₂ Ph	SO ₂ Me
H	O	CH=CHPh	SO ₂ Me

表 3 6

R^2	L	R^{12}	R^{13}
H	O	$CH_2CH=CHPh$	SO_2Me
H	O	$C\equiv CPh$	SO_2Me
H	O	$CH_2C\equiv CPh$	SO_2Me
H	O	G (a)	SO_2Me
H	O	G (b)	SO_2Me
H	O	G (c)	SO_2Me
H	O	G (d)	SO_2Me
Me	O	H	H
Me	O	Me	H
Me	O	Et	H
Me	O	Pr	H
Me	O	i-Pr	H
Me	O	Bu	H
Me	O	s-Bu	H
Me	O	i-Bu	H
Me	O	t-Bu	H
Me	O	Pen	H
Me	O	Hex	H
Me	O	Hep	H
Me	O	$CH_2CH=CH_2$	H
Me	O	$CH_2C(Me)=CH_2$	H
Me	O	$CH_2CH=CHMe$	H
Me	O	$CH_2CH=CMe_2$	H

表 3 7

R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	O	$CH(Me)CH=CH_2$	H
Me	O	$C(Me)_2CH=CH_2$	H
Me	O	$CH_2C\equiv CH$	H
Me	O	$CH_2C\equiv CMe$	H
Me	O	$CH(Me)C\equiv CH$	H
Me	O	$C(Me)_2C\equiv CH$	H
Me	O	$(CH_2)_2C\equiv CH$	H
Me	O	CH_2CF_3	H
Me	O	$(CH_2)_2Cl$	H
Me	O	$(CH_2)_3Cl$	H
Me	O	$(CH_2)_3Br$	H
Me	O	$(CH_2)_3F$	H
Me	O	$CH_2CH=CHCl$	H
Me	O	$CH_2CH=CCl_2$	H
Me	O	c-Pr	H
Me	O	c-Bu	H
Me	O	c-Pen	H
Me	O	c-Hex	H
Me	O	c-Hep	H
Me	O	CH_2OH	H
Me	O	$(CH_2)_2OH$	H
Me	O	CH_2OMe	H
Me	O	CH_2OEt	H

表 3 8

R ²	L	R ¹²	R ¹³
Me	O	(CH ₂) ₂ OMe	H
Me	O	(CH ₂) ₂ OEt	H
Me	O	(CH ₂) ₃ OMe	H
Me	O	(CH ₂) ₃ OEt	H
Me	O	CH ₂ SMe	H
Me	O	CN	H
Me	O	Ph	H
Me	O	CH ₂ Ph (4-OMe)	H
Me	O	CH(Me)Ph	H
Me	O	(CH ₂) ₂ Ph	H
Me	O	CH=CHPh	H
Me	O	CH ₂ CH=CHPh	H
Me	O	C≡CPh	H
Me	O	CH ₂ C≡CPh	H
Me	O	G (a)	H
Me	O	G (b)	H
Me	O	G (c)	H
Me	O	G (d)	H
Me	O	Me	Me
Me	O	Et	Me
Me	O	Pr	Me
Me	O	i-Pr	Me

表 3 9

R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	O	Bu	Me
Me	O	s-Bu	Me
Me	O	i-Bu	Me
Me	O	t-Bu	Me
Me	O	Pen	Me
Me	O	Hex	Me
Me	O	Hept	Me
Me	O	$CH_2CH=CH_2$	Me
Me	O	$CH_2C(Me)=CH_2$	Me
Me	O	$CH_2CH=CHMe$	Me
Me	O	$CH_2CH=CMe_2$	Me
Me	O	$CH(Me)CH=CH_2$	Me
Me	O	$C(Me)_2CH=CH_2$	Me
Me	O	$CH_2C\equiv CH$	Me
Me	O	$CH_2C\equiv CMe$	Me
Me	O	$CH(Me)C\equiv CH$	Me
Me	O	$C(Me)_2C\equiv CH$	Me
Me	O	$(CH_2)_2C\equiv CH$	Me
Me	O	CH_2CF_3	Me
Me	O	$(CH_2)_2Cl$	Me
Me	O	$(CH_2)_3Cl$	Me
Me	O	$(CH_2)_3Br$	Me
Me	O	$(CH_2)_3F$	Me

表 4 0

R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	O	$CH_2CH=CHCl$	Me
Me	O	$CH_2CH=CCl_2$	Me
Me	O	c-Pr	Me
Me	O	c-Bu	Me
Me	O	c-Pen	Me
Me	O	c-Hex	Me
Me	O	c-Hep	Me
Me	O	CH_2OH	Me
Me	O	$(CH_2)_2OH$	Me
Me	O	CH_2OMe	Me
Me	O	CH_2OEt	Me
Me	O	$(CH_2)_2OMe$	Me
Me	O	$(CH_2)_2OEt$	Me
Me	O	$(CH_2)_3OMe$	Me
Me	O	$(CH_2)_3OEt$	Me
Me	O	CH_2SMe	Me
Me	O	CN	Me
Me	O	Ph	Me
Me	O	CH_2Ph (4-OMe)	Me
Me	O	$CH(Me)Ph$	Me
Me	O	$(CH_2)_2Ph$	Me
Me	O	$CH=CHPh$	Me
Me	O	$CH_2CH=CHPh$	Me

表 4 1

R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	O	$C \equiv CPh$	Me
Me	O	$CH_2C \equiv CPh$	Me
Me	O	G (a)	Me
Me	O	G (b)	Me
Me	O	G (c)	Me
Me	O	G (d)	Me
Me	O	Et	Et
Me	O	Pr	Et
Me	O	i-Pr	Et
Me	O	Bu	Et
Me	O	s-Bu	Et
Me	O	i-Bu	Et
Me	O	t-Bu	Et
Me	O	Pen	Et
Me	O	Hex	Et
Me	O	Hept	Et
Me	O	$CH_2CH=CH_2$	Et
Me	O	$CH_2C(Me)=CH_2$	Et
Me	O	$CH_2CH=CHMe$	Et
Me	O	$CH_2CH=CMe_2$	Et
Me	O	$CH(Me)CH=CH_2$	Et

表 4 2

R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	O	$C(Me)_2CH=CH_2$	Et
Me	O	$CH_2C\equiv CH$	Et
Me	O	$CH_2C\equiv CMe$	Et
Me	O	$CH(Me)C\equiv CH$	Et
Me	O	$C(Me)_2C\equiv CH$	Et
Me	O	$(CH_2)_2C\equiv CH$	Et
Me	O	CH_2CF_3	Et
Me	O	$(CH_2)_2Cl$	Et
Me	O	$(CH_2)_3Cl$	Et
Me	O	$(CH_2)_3Br$	Et
Me	O	$(CH_2)_3F$	Et
Me	O	$CH_2CH=CHCl$	Et
Me	O	$CH_2CH=CCl_2$	Et
Me	O	c-Pr	Et
Me	O	c-Bu	Et
Me	O	c-Pen	Et
Me	O	c-Hex	Et
Me	O	c-Hep	Et
Me	O	CH_2OH	Et
Me	O	$(CH_2)_2OH$	Et
Me	O	CH_2OMe	Et
Me	O	CH_2OEt	Et
Me	O	$(CH_2)_2OMe$	Et

表 4 3

R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	O	$(CH_2)_2OEt$	Et
Me	O	$(CH_2)_3OMe$	Et
Me	O	$(CH_2)_3OEt$	Et
Me	O	CH_2SMe	Et
Me	O	CN	Et
Me	O	Ph	Et
Me	O	CH_2Ph (4-OMe)	Et
Me	O	$CH(Me)Ph$	Et
Me	O	$(CH_2)_2Ph$	Et
Me	O	$CH=CHPh$	Et
Me	O	$CH_2CH=CHPh$	Et
Me	O	$C\equiv CPh$	Et
Me	O	$CH_2C\equiv CPh$	Et
Me	O	G (a)	Et
Me	O	G (b)	Et
Me	O	G (c)	Et
Me	O	G (d)	Et
Me	O	Pr	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	i-Pr	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	Bu	$CH_2CH=CH_2$

表 4 4

R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	O	s-Bu	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	i-Bu	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	t-Bu	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	Pen	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	Hex	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	Hep	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$CH_2CH=CH_2$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$CH_2C(Me)=CH_2$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$CH_2CH=CHMe$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$CH_2CH=CMe_2$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$CH(Me)CH=CH_2$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$C(Me)_2CH=CH_2$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$CH_2C\equiv CH$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$CH_2C\equiv CMe$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$CH(Me)C\equiv CH$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$C(Me)_2C\equiv CH$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$(CH_2)_2C\equiv CH$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	CH_2CF_3	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$(CH_2)_2Cl$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$(CH_2)_3Cl$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$(CH_2)_3Br$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$(CH_2)_3F$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$CH_2CH=CHCl$	$CH_2CH=CH_2$

表 4 5

R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	O	$CH_2CH=CCl_2$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	c-Pr	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	c-Bu	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	c-Pen	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	c-Hex	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	c-Hep	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	CH_2OH	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$(CH_2)_2OH$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	CH_2OMe	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	CH_2OEt	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$(CH_2)_2OMe$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$(CH_2)_2OEt$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$(CH_2)_3OMe$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$(CH_2)_3OEt$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	CH_2SMe	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	CN	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	Ph	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	CH_2Ph (4-OMe)	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$CH(Me)Ph$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$(CH_2)_2Ph$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$CH=CHPh$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$CH_2CH=CHPh$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	$C\equiv CPh$	$CH_2CH=CH_2$

表 4 6

R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	O	$CH_2C \equiv CPh$	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	G (a)	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	G (b)	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	G (c)	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	G (d)	$CH_2CH=CH_2$
Me	O	H	COMe
Me	O	Me	COMe
Me	O	Et	COMe
Me	O	Pr	COMe
Me	O	i-Pr	COMe
Me	O	Bu	COMe
Me	O	s-Bu	COMe
Me	O	i-Bu	COMe
Me	O	t-Bu	COMe
Me	O	Pen	COMe
Me	O	Hex	COMe
Me	O	Hept	COMe
Me	O	$CH_2CH=CH_2$	COMe
Me	O	$CH_2C(Me)=CH_2$	COMe
Me	O	$CH_2CH=CHMe$	COMe
Me	O	$CH_2CH=CMe_2$	COMe
Me	O	$CH(Me)CH=CH_2$	COMe
Me	O	$C(Me)_2CH=CH_2$	COMe

表 4 7

R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	O	$CH_2C \equiv CH$	COMe
Me	O	$CH_2C \equiv CMe$	COMe
Me	O	$CH(Me)C \equiv CH$	COMe
Me	O	$C(Me)_2C \equiv CH$	COMe
Me	O	$(CH_2)_2C \equiv CH$	COMe
Me	O	CH_2CF_3	COMe
Me	O	$(CH_2)_2Cl$	COMe
Me	O	$(CH_2)_3Cl$	COMe
Me	O	$(CH_2)_3Br$	COMe
Me	O	$(CH_2)_3F$	COMe
Me	O	$CH_2CH=CHC \overset{\circ}{I}$	COMe
Me	O	$CH_2CH=CCl_2$	COMe
Me	O	c-Pr	COMe
Me	O	c-Bu	COMe
Me	O	c-Pen	COMe
Me	O	c-Hex	COMe
Me	O	c-Hep	COMe
Me	O	CH_2OH	COMe
Me	O	$(CH_2)_2OH$	COMe
Me	O	CH_2OMe	COMe
Me	O	CH_2OEt	COMe
Me	O	$(CH_2)_2OMe$	COMe
Me	O	$(CH_2)_2OEt$	COMe

表 4 8

R ²	L	R ¹²	R ¹³
Me	O	(CH ₂) ₃ OMe	COMe
Me	O	(CH ₂) ₃ OEt	COMe
Me	O	CH ₂ SM e	COMe
Me	O	CN	COMe
Me	O	Ph	COMe
Me	O	CH ₂ Ph (4-OMe)	COMe
Me	O	CH (Me) Ph	COMe
Me	O	(CH ₂) ₂ Ph	COMe
Me	O	CH=CHPh	COMe
Me	O	CH ₂ CH=CHPh	COMe
Me	O	C≡CPh	COMe
Me	O	CH ₂ C≡CPh	COMe
Me	O	G (a)	COMe
Me	O	G (b)	COMe
Me	O	G (c)	COMe
Me	O	G (d)	COMe
Me	O	H	CO-t-Bu
Me	O	Me	CO-t-Bu
Me	O	Et	CO-t-Bu
Me	O	Pr	CO-t-Bu
Me	O	i-Pr	CO-t-Bu
Me	O	Bu	CO-t-Bu
Me	O	s-Bu	CO-t-Bu

表 4 9

R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	O	i-Bu	CO-t-Bu
Me	O	t-Bu	CO-t-Bu
Me	O	Pen	CO-t-Bu
Me	O	Hex	CO-t-Bu
Me	O	Hept	CO-t-Bu
Me	O	$CH_2CH=CH_2$	CO-t-Bu
Me	O	$CH_2C(Me)=CH_2$	CO-t-Bu
Me	O	$CH_2CH=CHMe$	CO-t-Bu
Me	O	$CH_2CH=CM_e_2$	CO-t-Bu
Me	O	$CH(Me)CH=CH_2$	CO-t-Bu
Me	O	$C(Me)_2CH=CH_2$	CO-t-Bu
Me	O	$CH_2C\equiv CH$	CO-t-Bu
Me	O	$CH_2C\equiv CMe$	CO-t-Bu
Me	O	$CH(Me)C\equiv CH$	CO-t-Bu
Me	O	$C(Me)_2C\equiv CH$	CO-t-Bu
Me	O	$(CH_2)_2C\equiv CH$	CO-t-Bu
Me	O	CH_2CF_3	CO-t-Bu
Me	O	$(CH_2)_2Cl$	CO-t-Bu
Me	O	$(CH_2)_3Cl$	CO-t-Bu
Me	O	$(CH_2)_3Br$	CO-t-Bu
Me	O	$(CH_2)_3F$	CO-t-Bu
Me	O	$CH_2CH=CHCl$	CO-t-Bu
Me	O	$CH_2CH=CCl_2$	CO-t-Bu

表 5 0

R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	O	c - P r	CO - t - B u
Me	O	c - B u	CO - t - B u
Me	O	c - P e n	CO - t - B u
Me	O	c - H e x	CO - t - B u
Me	O	c - H e p	CO - t - B u
Me	O	CH ₂ OH	CO - t - B u
Me	O	(CH ₂) ₂ OH	CO - t - B u
Me	O	CH ₂ OMe	CO - t - B u
Me	O	CH ₂ OE t	CO - t - B u
Me	O	(CH ₂) ₂ OMe	CO - t - B u
Me	O	(CH ₂) ₂ OE t	CO - t - B u
Me	O	(CH ₂) ₃ OMe	CO - t - B u
Me	O	(CH ₂) ₃ OE t	CO - t - B u
Me	O	CH ₂ SMe	CO - t - B u
Me	O	CN	CO - t - B u
Me	O	Ph	CO - t - B u
Me	O	CH ₂ Ph (4 - OMe)	CO - t - B u
Me	O	CH (Me) Ph	CO - t - B u
Me	O	(CH ₂) ₂ Ph	CO - t - B u
Me	O	CH = CH Ph	CO - t - B u
Me	O	CH ₂ CH = CH Ph	CO - t - B u
Me	O	C \equiv C Ph	CO - t - B u
Me	O	CH ₂ C \equiv C Ph	CO - t - B u

表 5 1

R ²	L	R ¹²	R ¹³
Me	O	G (a)	CO-t-Bu
Me	O	G (b)	CO-t-Bu
Me	O	G (c)	CO-t-Bu
Me	O	G (d)	CO-t-Bu
Me	O	H	COPh (4-OMe)
Me	O	Me	COPh (4-OMe)
Me	O	Et	COPh (4-OMe)
Me	O	Pr	COPh (4-OMe)
Me	O	i-Pr	COPh (4-OMe)
Me	O	Bu	COPh (4-OMe)
Me	O	s-Bu	COPh (4-OMe)
Me	O	i-Bu	COPh (4-OMe)
Me	O	t-Bu	COPh (4-OMe)
Me	O	Pen	COPh (4-OMe)
Me	O	Hex	COPh (4-OMe)
Me	O	Hept	COPh (4-OMe)
Me	O	CH ₂ CH=CH ₂	COPh (4-OMe)
Me	O	CH ₂ C (Me) =CH ₂	COPh (4-OMe)
Me	O	CH ₂ CH=CHMe	COPh (4-OMe)
Me	O	CH ₂ CH=CMe ₂	COPh (4-OMe)
Me	O	CH (Me) CH=CH ₂	COPh (4-OMe)
Me	O	C (Me) ₂ CH=CH ₂	COPh (4-OMe)
Me	O	CH ₂ C≡CH	COPh (4-OMe)

表 5 2

R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	O	$CH_2C \equiv CMe$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	$CH(Me)C \equiv CH$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	$C(Me)_2C \equiv CH$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	$(CH_2)_2C \equiv CH$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	CH_2CF_3	$COPh(4-OMe)$
Me	O	$(CH_2)_2Cl$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	$(CH_2)_3Cl$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	$(CH_2)_3Br$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	$(CH_2)_3F$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	$CH_2CH=CHCl$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	$CH_2CH=CCl_2$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	c-Pr	$COPh(4-OMe)$
Me	O	c-Bu	$COPh(4-OMe)$
Me	O	c-Pen	$COPh(4-OMe)$
Me	O	c-Hex	$COPh(4-OMe)$
Me	O	c-Hep	$COPh(4-OMe)$
Me	O	CH_2OH	$COPh(4-OMe)$
Me	O	$(CH_2)_2OH$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	CH_2OMe	$COPh(4-OMe)$
Me	O	CH_2OEt	$COPh(4-OMe)$
Me	O	$(CH_2)_2OMe$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	$(CH_2)_2OEt$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	$(CH_2)_3OMe$	$COPh(4-OMe)$

表 5 3

R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	O	$(CH_2)_3OEt$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	CH_2SMe	$COPh(4-OMe)$
Me	O	CN	$COPh(4-OMe)$
Me	O	Ph	$COPh(4-OMe)$
Me	O	$CH_2Ph(4-OMe)$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	$CH(Me)Ph$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	$(CH_2)_2Ph$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	$CH=CHPh$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	$CH_2CH=CHPh$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	$C\equiv CPh$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	$CH_2C\equiv CPh$	$COPh(4-OMe)$
Me	O	G(a)	$COPh(4-OMe)$
Me	O	G(b)	$COPh(4-OMe)$
Me	O	G(c)	$COPh(4-OMe)$
Me	O	G(d)	$COPh(4-OMe)$
Me	O	H	CO_2Me
Me	O	Me	CO_2Me
Me	O	Et	CO_2Me
Me	O	Pr	CO_2Me
Me	O	i-Pr	CO_2Me
Me	O	Bu	CO_2Me
Me	O	s-Bu	CO_2Me
Me	O	i-Bu	CO_2Me

表 5 4

R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	O	t-Bu	CO ₂ Me
Me	O	Pen	CO ₂ Me
Me	O	Hex	CO ₂ Me
Me	O	Hep	CO ₂ Me
Me	O	CH ₂ CH=CH ₂	CO ₂ Me
Me	O	CH ₂ C(Me)=CH ₂	CO ₂ Me
Me	O	CH ₂ CH=CHMe	CO ₂ Me
Me	O	CH ₂ CH=CMe ₂	CO ₂ Me
Me	O	CH(Me)CH=CH ₂	CO ₂ Me
Me	O	C(Me) ₂ CH=CH ₂	CO ₂ Me
Me	O	CH ₂ C≡CH	CO ₂ Me
Me	O	CH ₂ C≡CMe	CO ₂ Me
Me	O	CH(Me)C≡CH	CO ₂ Me
Me	O	C(Me) ₂ C≡CH	CO ₂ Me
Me	O	(CH ₂) ₂ C≡CH	CO ₂ Me
Me	O	CH ₂ CF ₃	CO ₂ Me
Me	O	(CH ₂) ₂ Cl	CO ₂ Me
Me	O	(CH ₂) ₃ Cl	CO ₂ Me
Me	O	(CH ₂) ₃ Br	CO ₂ Me
Me	O	(CH ₂) ₃ F	CO ₂ Me
Me	O	CH ₂ CH=CHCl	CO ₂ Me
Me	O	CH ₂ CH=CCl ₂	CO ₂ Me
Me	O	c-Pr	CO ₂ Me

表 5 5

R ²	L	R ¹²	R ¹³
Me	O	c-Bu	CO ₂ Me
Me	O	c-Pen	CO ₂ Me
Me	O	c-Hex	CO ₂ Me
Me	O	c-Hep	CO ₂ Me
Me	O	CH ₂ OH	CO ₂ Me
Me	O	(CH ₂) ₂ OH	CO ₂ Me
Me	O	CH ₂ OMe	CO ₂ Me
Me	O	CH ₂ OE t	CO ₂ Me
Me	O	(CH ₂) ₂ OMe	CO ₂ Me
Me	O	(CH ₂) ₂ OE t	CO ₂ Me
Me	O	(CH ₂) ₃ OMe	CO ₂ Me
Me	O	(CH ₂) ₃ OE t	CO ₂ Me
Me	O	CH ₂ SMe	CO ₂ Me
Me	O	CN	CO ₂ Me
Me	O	Ph	CO ₂ Me
Me	O	CH ₂ Ph (4-OMe)	CO ₂ Me
Me	O	CH(Me)Ph	CO ₂ Me
Me	O	(CH ₂) ₂ Ph	CO ₂ Me
Me	O	CH=CHPh	CO ₂ Me
Me	O	CH ₂ CH=CHPh	CO ₂ Me
Me	O	C≡CPh	CO ₂ Me
Me	O	CH ₂ C≡CPh	CO ₂ Me
Me	O	G(a)	CO ₂ Me

表 5 6

R^2	L	$R^{1,2}$	$R^{1,3}$
Me	O	G (b)	CO ₂ Me
Me	O	G (c)	CO ₂ Me
Me	O	G (d)	CO ₂ Me
Me	O	H	SO ₂ Me
Me	O	Me	SO ₂ Me
Me	O	Et	SO ₂ Me
Me	O	Pr	SO ₂ Me
Me	O	i-Pr	SO ₂ Me
Me	O	Bu	SO ₂ Me
Me	O	s-Bu	SO ₂ Me
Me	O	i-Bu	SO ₂ Me
Me	O	t-Bu	SO ₂ Me
Me	O	Pen	SO ₂ Me
Me	O	Hex	SO ₂ Me
Me	O	Hept	SO ₂ Me
Me	O	CH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ Me
Me	O	CH ₂ C(Me)=CH ₂	SO ₂ Me
Me	O	CH ₂ CH=CHMe	SO ₂ Me
Me	O	CH ₂ CH=CM ₂	SO ₂ Me
Me	O	CH(Me)CH=CH ₂	SO ₂ Me
Me	O	C(Me) ₂ CH=CH ₂	SO ₂ Me
Me	O	CH ₂ C≡CH	SO ₂ Me
Me	O	CH ₂ C≡CMe	SO ₂ Me

表 5 7

R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	O	$CH(Me)C \equiv CH$	SO_2Me
Me	O	$C(Me)_2C \equiv CH$	SO_2Me
Me	O	$(CH_2)_2C \equiv CH$	SO_2Me
Me	O	CH_2CF_3	SO_2Me
Me	O	$(CH_2)_2Cl$	SO_2Me
Me	O	$(CH_2)_3Cl$	SO_2Me
Me	O	$(CH_2)_3Br$	SO_2Me
Me	O	$(CH_2)_3F$	SO_2Me
Me	O	$CH_2CH=CHCl$	SO_2Me
Me	O	$CH_2CH=CCl_2$	SO_2Me
Me	O	c-Pr	SO_2Me
Me	O	c-Bu	SO_2Me
Me	O	c-Pen	SO_2Me
Me	O	c-Hex	SO_2Me
Me	O	c-Hep	SO_2Me
Me	O	CH_2OH	SO_2Me
Me	O	$(CH_2)_2OH$	SO_2Me
Me	O	CH_2OMe	SO_2Me
Me	O	CH_2OEt	SO_2Me
Me	O	$(CH_2)_2OMe$	SO_2Me
Me	O	$(CH_2)_2OEt$	SO_2Me
Me	O	$(CH_2)_3OMe$	SO_2Me
Me	O	$(CH_2)_3OEt$	SO_2Me

表 5 8

R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	O	CH_2SMe	SO_2Me
Me	O	CN	SO_2Me
Me	O	Ph	SO_2Me
Me	O	CH_2Ph (4-OMe)	SO_2Me
Me	O	$CH(Me)Ph$	SO_2Me
Me	O	$(CH_2)_2Ph$	SO_2Me
Me	O	$CH=CHPh$	SO_2Me
Me	O	$CH_2CH=CHPh$	SO_2Me
Me	O	$C\equiv CPh$	SO_2Me
Me	O	$CH_2C\equiv CPh$	SO_2Me
Me	O	G (a)	SO_2Me
Me	O	G (b)	SO_2Me
Me	O	G (c)	SO_2Me
Me	O	G (d)	SO_2Me
H	O	$-(CH_2)_3-$	
H	O	$-(CH_2)_4-$	
H	O	$-(CH_2)_5-$	
H	O	$-(CH_2)_6-$	
H	O	$-(CH_2)_7-$	
H	O	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$	
H	O	$-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$	
Me	O	$-(CH_2)_3-$	
Me	O	$-(CH_2)_4-$	

表 5 9

R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	O	$-(CH_2)_5-$	
Me	O	$-(CH_2)_6-$	
Me	O	$-(CH_2)_7-$	
Me	O	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$	
Me	O	$-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$	
H	S	H	H
H	S	Me	H
H	S	Et	H
H	S	Pr	H
H	S	i-Pr	H
H	S	Bu	H
H	S	s-Bu	H
H	S	i-Bu	H
H	S	t-Bu	H
H	S	Pen	H
H	S	Hex	H
H	S	Hept	H
H	S	$CH_2CH=CH_2$	H
H	S	$CH_2C(Me)=CH_2$	H
H	S	$CH_2CH=CHMe$	H
H	S	$CH_2CH=CHMe_2$	H
H	S	$CH(Me)CH=CH_2$	H
H	S	$C(Me)_2CH=CH_2$	H

表 6 0

R^2	L	R^{12}	R^{13}
H	S	$CH_2C \equiv CH$	H
H	S	$CH_2C \equiv CMe$	H
H	S	$CH(Me)C \equiv CH$	H
H	S	$C(Me)_2C \equiv CH$	H
H	S	$(CH_2)_2C \equiv CH$	H
H	S	CH_2CF_3	H
H	S	$(CH_2)_2Cl$	H
H	S	$(CH_2)_3Cl$	H
H	S	$(CH_2)_3Br$	H
H	S	$(CH_2)_3F$	H
H	S	$CH_2CH=CHCl$	H
H	S	$CH_2CH=CCl_2$	H
H	S	c-Pr	H
H	S	c-Bu	H
H	S	c-Pen	H
H	S	c-Hex	H
H	S	c-Hep	H
H	S	CH_2OH	H
H	S	$(CH_2)_2OH$	H
H	S	CH_2OMe	H
H	S	CH_2OEt	H
H	S	$(CH_2)_2OMe$	H
H	S	$(CH_2)_2OEt$	H

表 6 1

R ²	L	R ¹²	R ¹³
H	S	(CH ₂) ₃ OMe	H
H	S	(CH ₂) ₃ OEt	H
H	S	CH ₂ SM e	H
H	S	CN	H
H	S	Ph	H
H	S	CH ₂ Ph (4-OMe)	H
H	S	CH (Me) Ph	H
H	S	(CH ₂) ₂ Ph	H
H	S	CH=CHPh	H
H	S	CH ₂ CH=CHPh	H
H	S	C≡CPh	H
H	S	CH ₂ C≡CPh	H
H	S	G (a)	H
H	S	G (b)	H
H	S	G (c)	H
H	S	G (d)	H
Me	S	H	H
Me	S	Me	H
Me	S	Et	H
Me	S	Pr	H
Me	S	i-Pr	H
Me	S	Bu	H
Me	S	s-Bu	H

表 6 2

R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	S	i-Bu	H
Me	S	t-Bu	H
Me	S	Pen	H
Me	S	Hex	H
Me	S	Hept	H
Me	S	$CH_2CH=CH_2$	H
Me	S	$CH_2C(Me)=CH_2$	H
Me	S	$CH_2CH=CHMe$	H
Me	S	$CH_2CH=CMe_2$	H
Me	S	$CH(Me)CH=CH_2$	H
Me	S	$C(Me)_2CH=CH_2$	H
Me	S	$CH_2C\equiv CH$	H
Me	S	$CH_2C\equiv CMe$	H
Me	S	$CH(Me)C\equiv CH$	H
Me	S	$C(Me)_2C\equiv CH$	H
Me	S	$(CH_2)_2C\equiv CH$	H
Me	S	CH_2CF_3	H
Me	S	$(CH_2)_2Cl$	H
Me	S	$(CH_2)_3Cl$	H
Me	S	$(CH_2)_3Br$	H
Me	S	$(CH_2)_3F$	H
Me	S	$CH_2CH=CHCl$	H
Me	S	$CH_2CH=CCl_2$	H

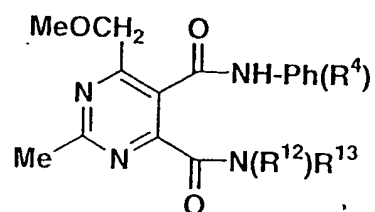
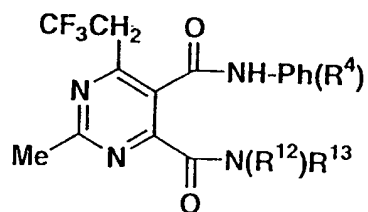
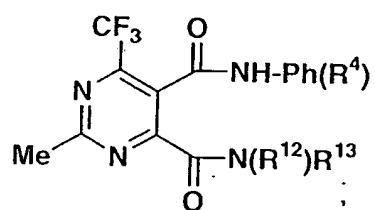
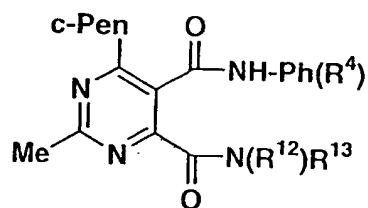
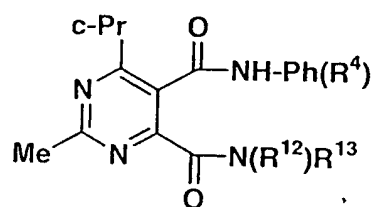
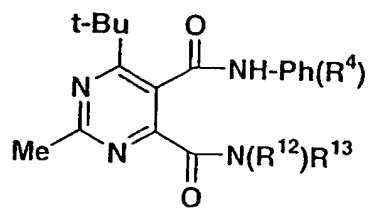
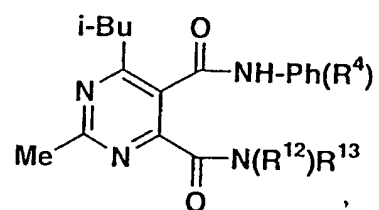
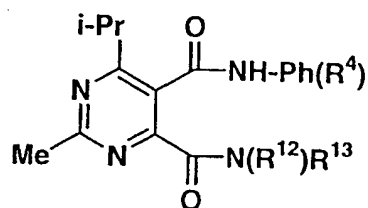
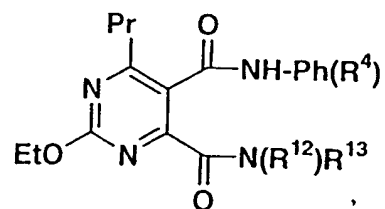
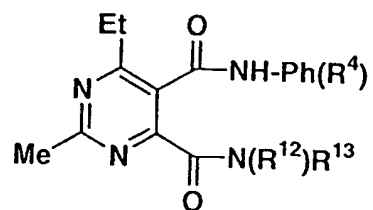
表 6 3

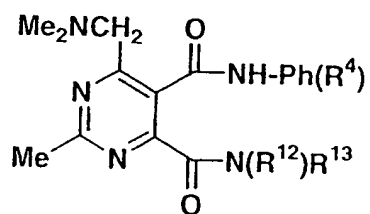
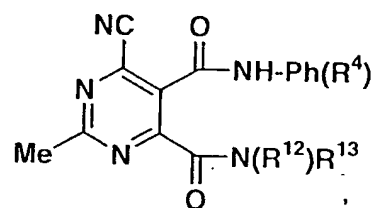
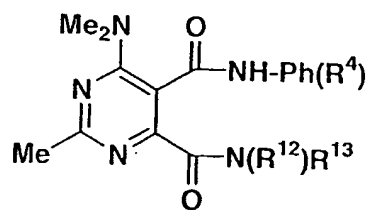
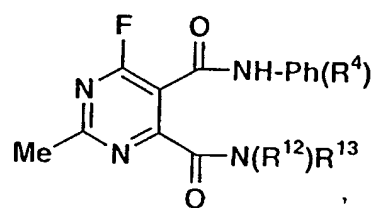
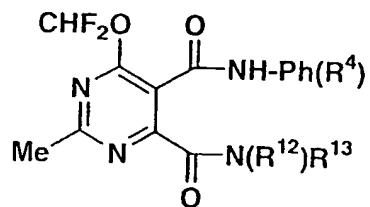
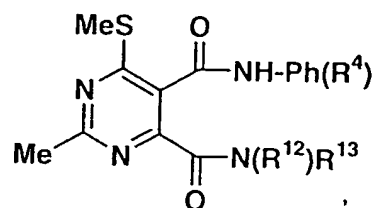
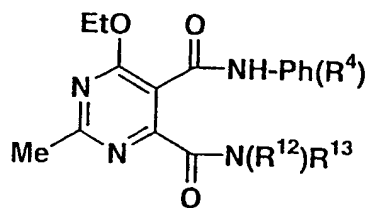
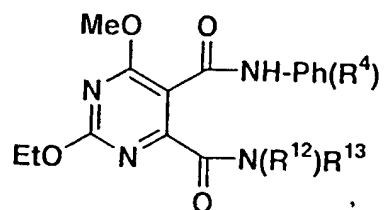
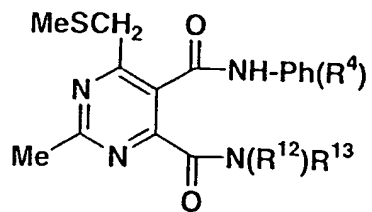
R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	S	c - P r	H
Me	S	c - B u	H
Me	S	c - P e n	H
Me	S	c - H e x	H
Me	S	c - H e p	H
Me	S	CH ₂ OH	H
Me	S	(CH ₂) ₂ OH	H
Me	S	CH ₂ OMe	H
Me	S	CH ₂ OE t	H
Me	S	(CH ₂) ₂ OMe	H
Me	S	(CH ₂) ₂ OE t	H
Me	S	(CH ₂) ₃ OMe	H
Me	S	(CH ₂) ₃ OE t	H
Me	S	CH ₂ SMe	H
Me	S	CN	H
Me	S	P h	H
Me	S	CH ₂ P h (4 - OMe)	H
Me	S	CH (Me) P h	H
Me	S	(CH ₂) ₂ P h	H
Me	S	CH = CH P h	H
Me	S	CH ₂ CH = CH P h	H
Me	S	C \equiv C P h	H
Me	S	CH ₂ C \equiv C P h	H

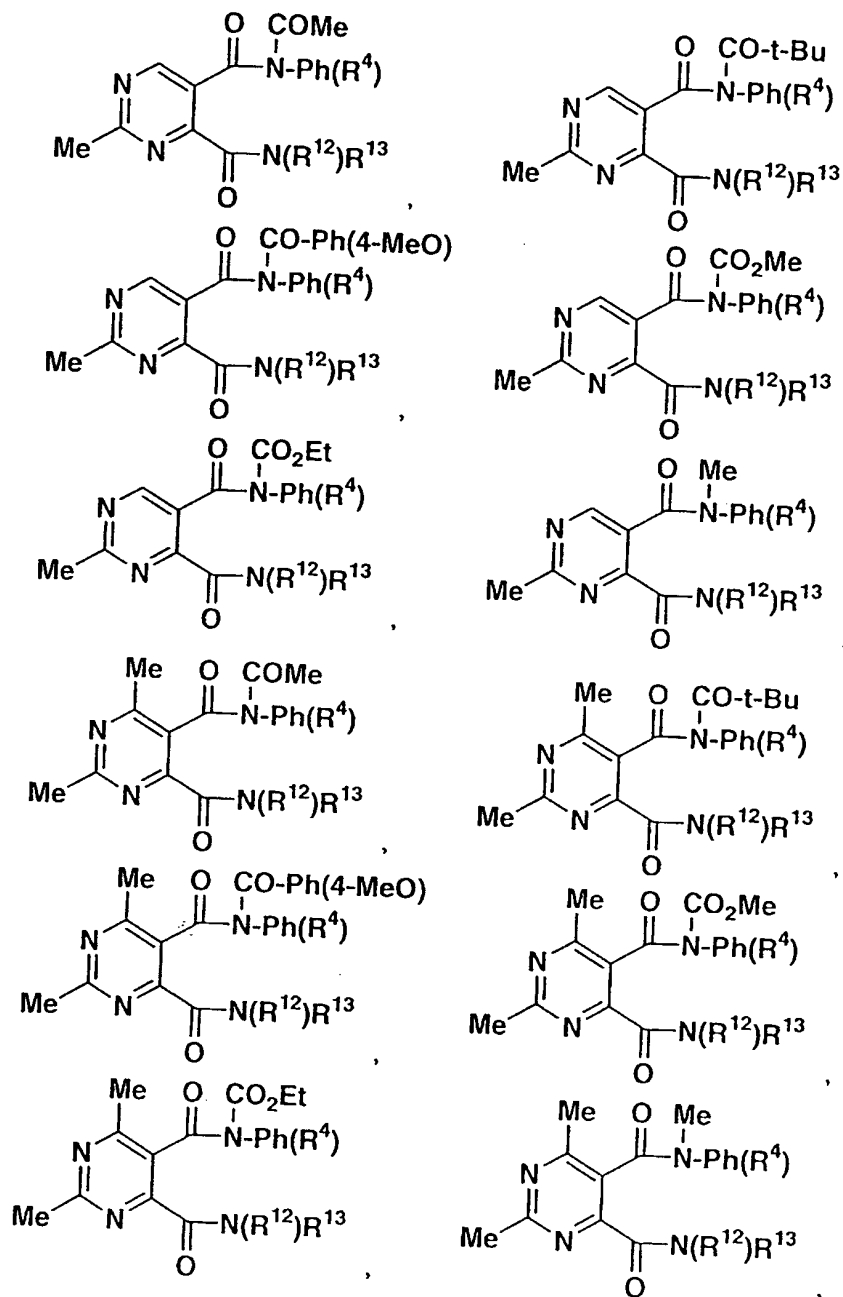
表 6 4

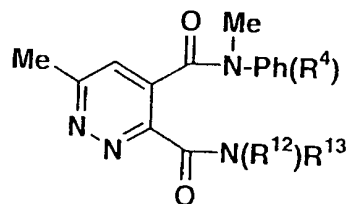
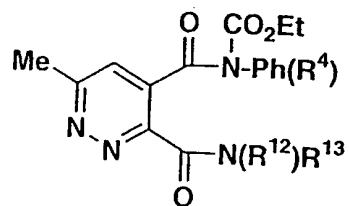
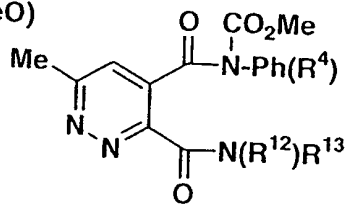
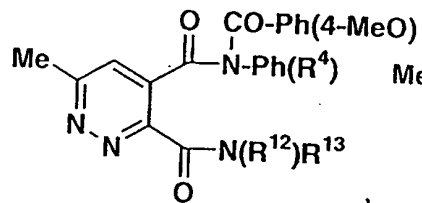
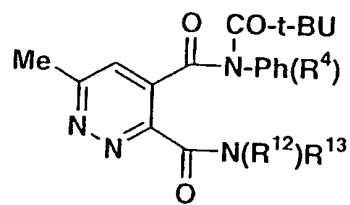
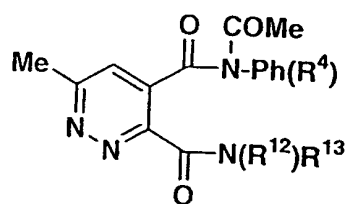
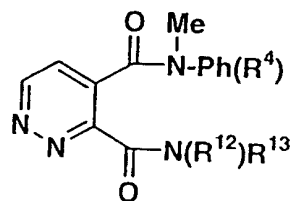
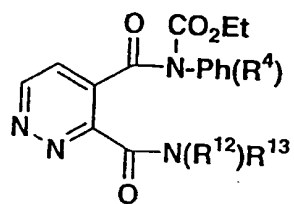
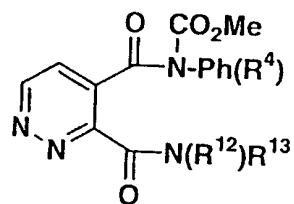
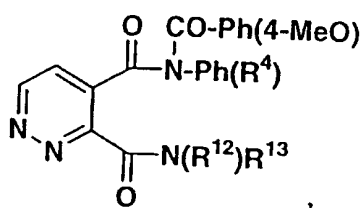
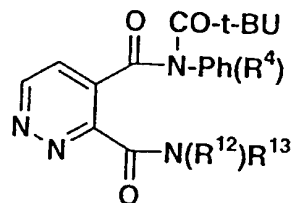
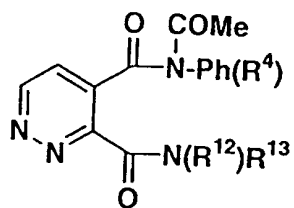
R^2	L	R^{12}	R^{13}
Me	S	G (a)	H
Me	S	G (b)	H
Me	S	G (c)	H
Me	S	G (d)	H
H	S	$-(CH_2)_3-$	
H	S	$-(CH_2)_4-$	
H	S	$-(CH_2)_5-$	
H	S	$-(CH_2)_6-$	
H	S	$-(CH_2)_7-$	
H	S	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$	
H	S	$-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$	
Me	S	$-(CH_2)_3-$	
Me	S	$-(CH_2)_4-$	
Me	S	$-(CH_2)_5-$	
Me	S	$-(CH_2)_6-$	
Me	S	$-(CH_2)_7-$	
Me	S	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$	
Me	S	$-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$	

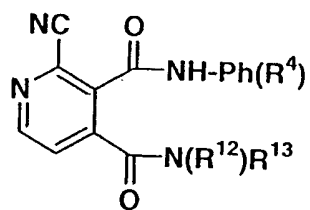
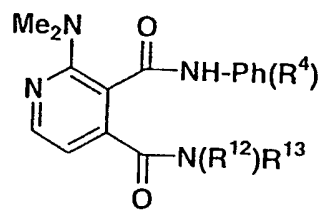
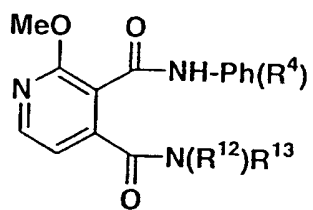
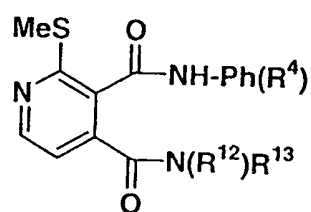
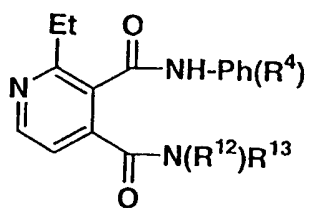
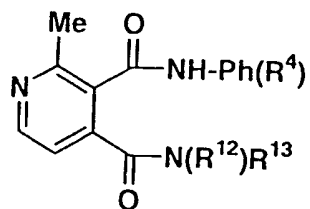
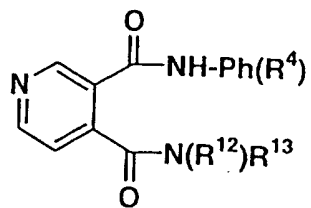
[第 1 表]

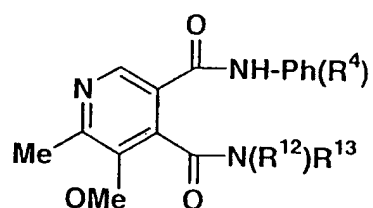
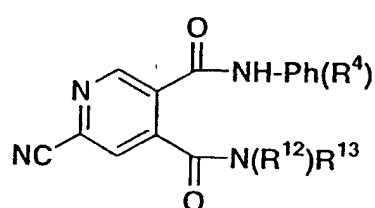
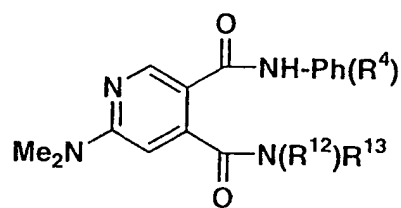
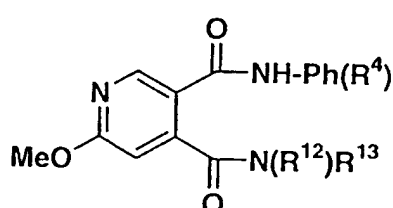
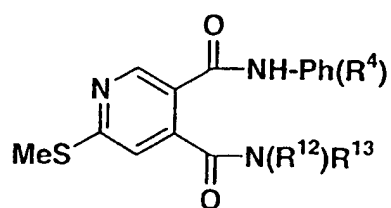
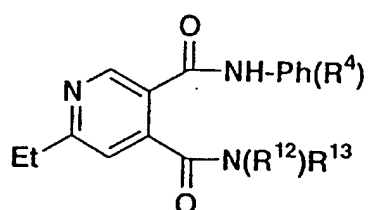
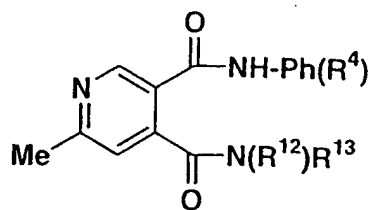


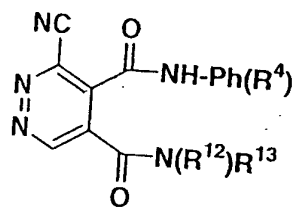
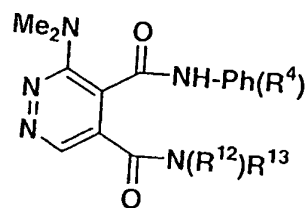
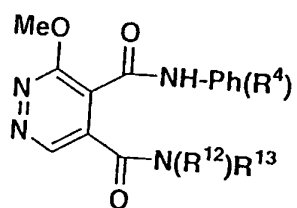
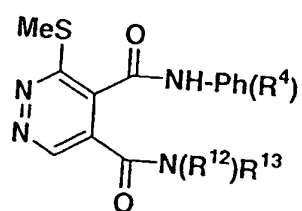
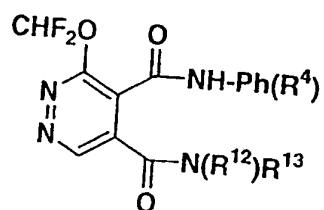
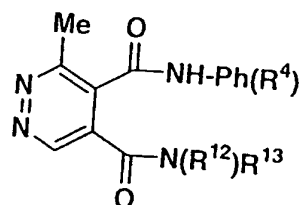
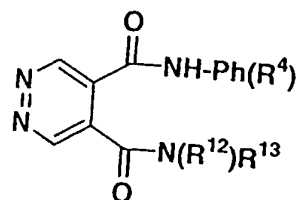


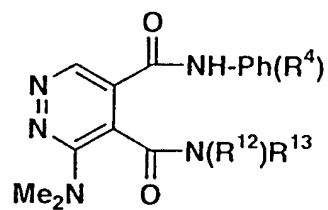
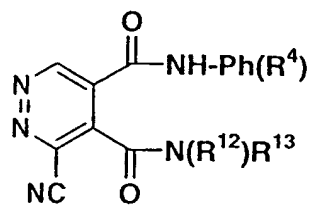
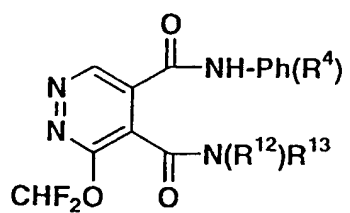
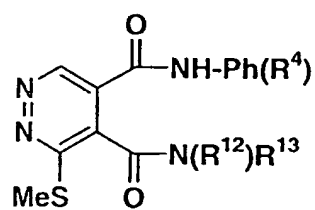
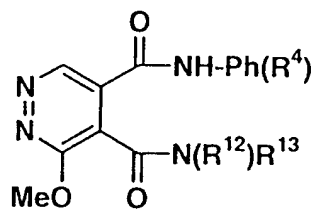
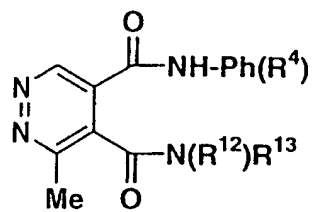


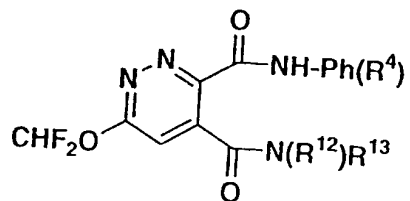
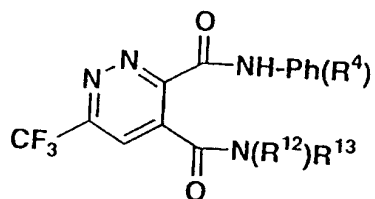
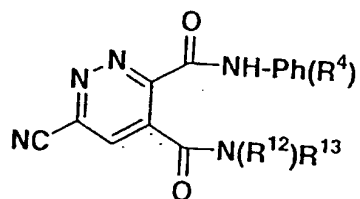
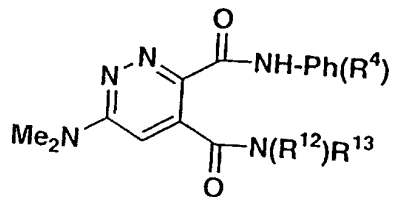
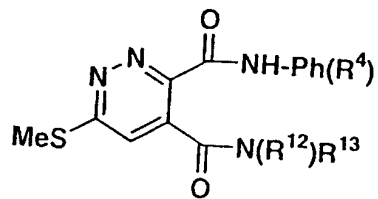
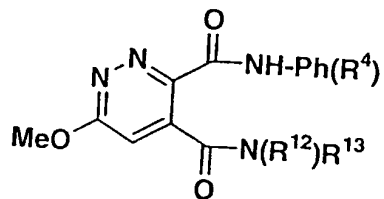
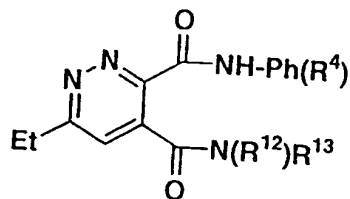
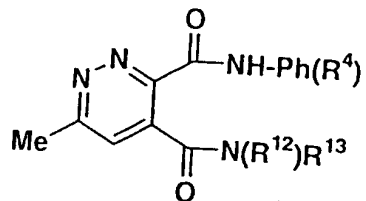
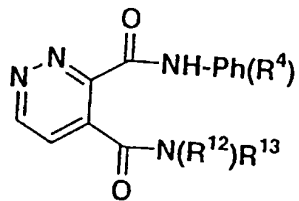


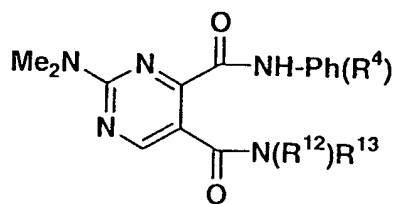
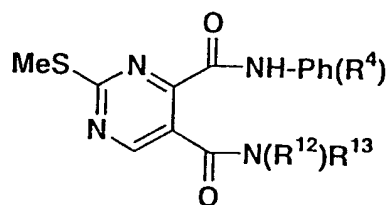
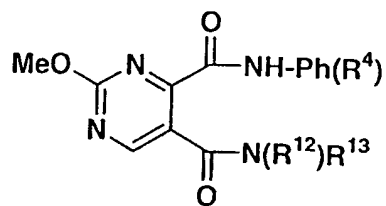
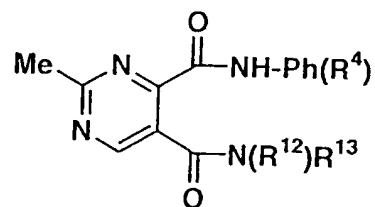
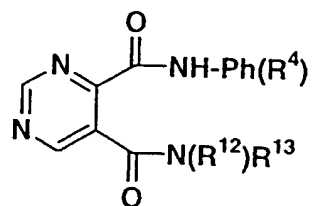












or

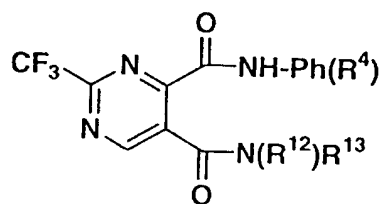


表 6 5

R ¹²	R ¹³
H	H
Me	H
Et	H
Pr	H
i-Pr	H
Bu	H
s-Bu	H
i-Bu	H
t-Bu	H
Pen	H
Hex	H
Hep	H
CH ₂ CH=CH ₂	H
CH ₂ C(Me)=CH ₂	H
CH ₂ CH=CHMe	H
CH ₂ CH=CMe ₂	H
CH(Me)CH=CH ₂	H
C(Me) ₂ CH=CH ₂	H
CH ₂ C≡CH	H
CH ₂ C≡CMe	H
CH(Me)C≡CH	H
C(Me) ₂ C≡CH	H
(CH ₂) ₂ C≡CH	H

表 6 6

R ¹²	R ¹³
CH ₂ CF ₃	H
(CH ₂) ₂ Cl	H
(CH ₂) ₃ Cl	H
(CH ₂) ₃ Br	H
(CH ₂) ₃ F	H
CH ₂ CH=CHCl	H
CH ₂ CH=CCl ₂	H
c-Pr	H
c-Bu	H
c-Pen	H
c-Hex	H
c-Hept	H
CH ₂ OH	H
(CH ₂) ₂ OH	H
CH ₂ OMe	H
CH ₂ OEt	H
(CH ₂) ₂ OMe	H
(CH ₂) ₂ OEt	H
(CH ₂) ₃ OMe	H
(CH ₂) ₃ OEt	H
CH ₂ SMe	H
CN	H
Ph	H

表 6 7

R ¹²	R ¹³
CH ₂ Ph (4-OMe)	H
CH(Me)Ph	H
(CH ₂) ₂ Ph	H
CH=CHPh	H
CH ₂ CH=CHPh	H
C≡CPh	H
CH ₂ C≡CPh	H
G(a)	H
G(b)	H
G(c)	H
G(d)	H
Me	Me
Et	Me
Pr	Me
i-Pr	Me
Bu	Me
s-Bu	Me
i-Bu	Me
t-Bu	Me
Pen	Me
Hex	Me
Hept	Me

表 6 8

R^{12}	R^{13}
$CH_2CH=CH_2$	Me
$CH_2C(Me)=CH_2$	Me
$CH_2CH=CHMe$	Me
$CH_2CH=CMe_2$	Me
$CH(Me)CH=CH_2$	Me
$C(Me)_2CH=CH_2$	Me
$CH_2C\equiv CH$	Me
$CH_2C\equiv CMe$	Me
$CH(Me)C\equiv CH$	Me
$C(Me)_2C\equiv CH$	Me
$(CH_2)_2C\equiv CH$	Me
CH_2CF_3	Me
$(CH_2)_2Cl$	Me
$(CH_2)_3Cl$	Me
$(CH_2)_3Br$	Me
$(CH_2)_3F$	Me
$CH_2CH=CHCl$	Me
$CH_2CH=CCl_2$	Me
c-Pr	Me
c-Bu	Me
c-Pen	Me
c-Hex	Me
c-Hep	Me

表 6 9

R ¹²	R ¹³
CH ₂ OH	Me
(CH ₂) ₂ OH	Me
CH ₂ OMe	Me
CH ₂ OEt	Me
(CH ₂) ₂ OMe	Me
(CH ₂) ₂ OEt	Me
(CH ₂) ₃ OMe	Me
(CH ₂) ₃ OEt	Me
CH ₂ SMe	Me
CN	Me
Ph	Me
CH ₂ Ph (4-OMe)	Me
CH(Me)Ph	Me
(CH ₂) ₂ Ph	Me
CH=CHPh	Me
CH ₂ CH=CHPh	Me
C≡CPh	Me
CH ₂ C≡CPh	Me
G(a)	Me
G(b)	Me
G(c)	Me
G(d)	Me

表 7 0

R ¹²	R ¹³
E t	E t
P r	E t
i - P r	E t
B u	E t
s - B u	E t
i - B u	E t
t - B u	E t
P e n	E t
H e x	E t
H e p	E t
CH ₂ CH=CH ₂	E t
CH ₂ C (M e) =CH ₂	E t
CH ₂ CH=CHM e	E t
CH ₂ CH=CM e ₂	E t
CH (M e) CH=CH ₂	E t
C (M e) ₂ CH=CH ₂	E t
CH ₂ C≡CH	E t
CH ₂ C≡CM e	E t
CH (M e) C≡CH	E t
C (M e) ₂ C≡CH	E t
(CH ₂) ₂ C≡CH	E t
CH ₂ CF ₃	E t

表 7 1

R ¹²	R ¹³
(CH ₂) ₂ Cl	Et
(CH ₂) ₃ Cl	Et
(CH ₂) ₃ Br	Et
(CH ₂) ₃ F	Et
CH ₂ CH=CHCl	Et
CH ₂ CH=CCl ₂	Et
c-Pr	Et
c-Bu	Et
c-Pen	Et
c-Hex	Et
c-Hep	Et
CH ₂ OH	Et
(CH ₂) ₂ OH	Et
CH ₂ OMe	Et
CH ₂ OEt	Et
(CH ₂) ₂ OMe	Et
(CH ₂) ₂ OEt	Et
(CH ₂) ₃ OMe	Et
(CH ₂) ₃ OEt	Et
CH ₂ SMe	Et
CN	Et
Ph	Et
CH ₂ Ph (4-OMe)	Et

表 7 2

R^{12}	R^{13}
CH (Me) Ph	Et
(CH ₂) ₂ Ph	Et
CH=CHPh	Et
CH ₂ CH=CHPh	Et
C≡CPh	Et
CH ₂ C≡CPh	Et
G (a)	Et
G (b)	Et
G (c)	Et
G (d)	Et
Pr	CH ₂ CH=CH ₂
i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂
Bu	CH ₂ CH=CH ₂
s-Bu	CH ₂ CH=CH ₂
i-Bu	CH ₂ CH=CH ₂
t-Bu	CH ₂ CH=CH ₂
Pen	CH ₂ CH=CH ₂
Hex	CH ₂ CH=CH ₂
Hep	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂

表 7 3

R^{12}	R^{13}
$CH_2C(Me)=CH_2$	$CH_2CH=CH_2$
$CH_2CH=CHMe$	$CH_2CH=CH_2$
$CH_2CH=CMe_2$	$CH_2CH=CH_2$
$CH(Me)CH=CH_2$	$CH_2CH=CH_2$
$C(Me)_2CH=CH_2$	$CH_2CH=CH_2$
$CH_2C\equiv CH$	$CH_2CH=CH_2$
$CH_2C\equiv CMe$	$CH_2CH=CH_2$
$CH(Me)C\equiv CH$	$CH_2CH=CH_2$
$C(Me)_2C\equiv CH$	$CH_2CH=CH_2$
$(CH_2)_2C\equiv CH$	$CH_2CH=CH_2$
CH_2CF_3	$CH_2CH=CH_2$
$(CH_2)_2Cl$	$CH_2CH=CH_2$
$(CH_2)_3Cl$	$CH_2CH=CH_2$
$(CH_2)_3Br$	$CH_2CH=CH_2$
$(CH_2)_3F$	$CH_2CH=CH_2$
$CH_2CH=CHCl$	$CH_2CH=CH_2$
$CH_2CH=CCl_2$	$CH_2CH=CH_2$
$c-Pr$	$CH_2CH=CH_2$
$c-Bu$	$CH_2CH=CH_2$
$c-Pen$	$CH_2CH=CH_2$
$c-Hex$	$CH_2CH=CH_2$
$c-Hep$	$CH_2CH=CH_2$
CH_2OH	$CH_2CH=CH_2$

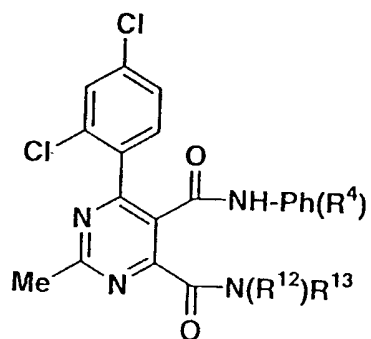
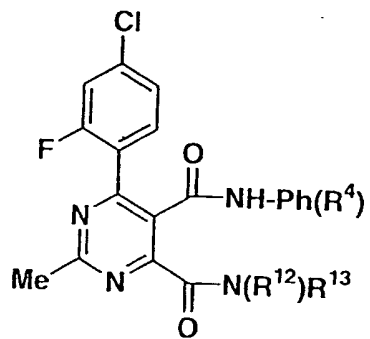
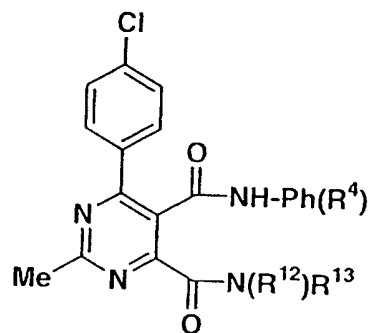
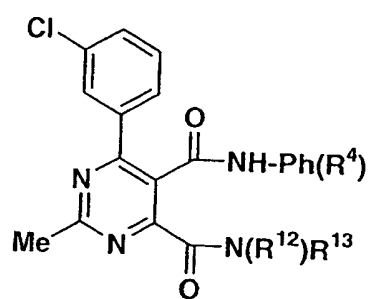
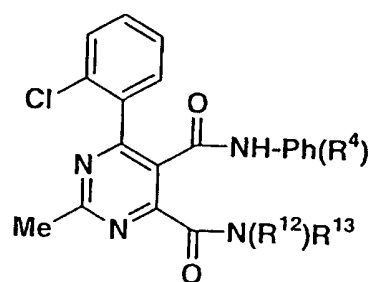
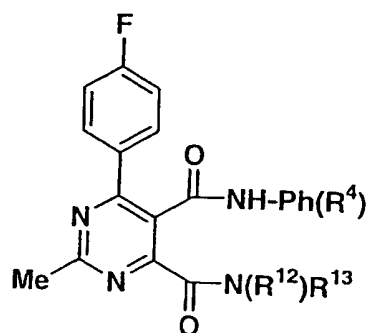
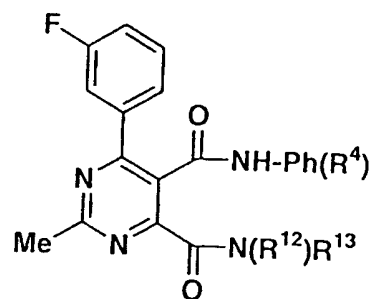
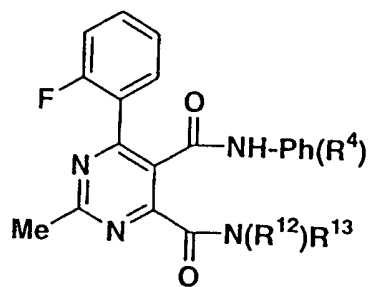
表 7 4

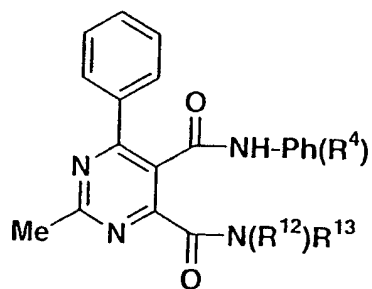
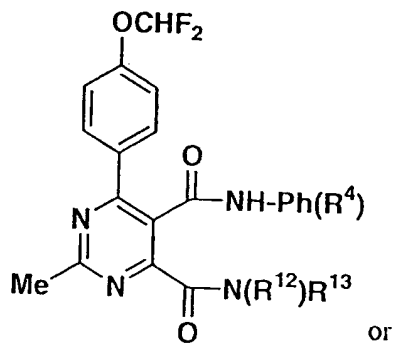
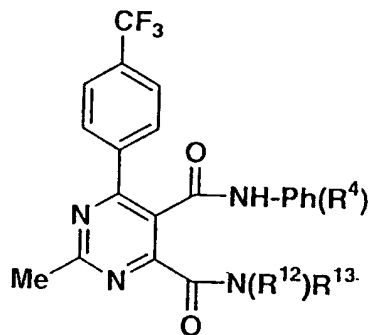
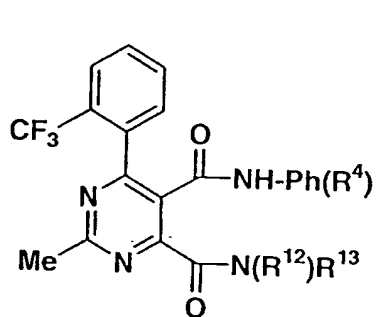
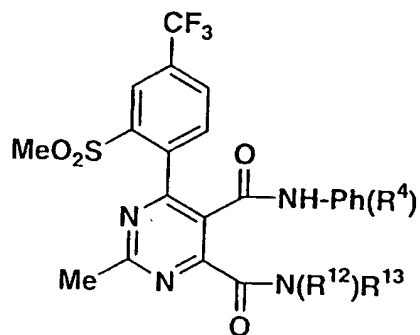
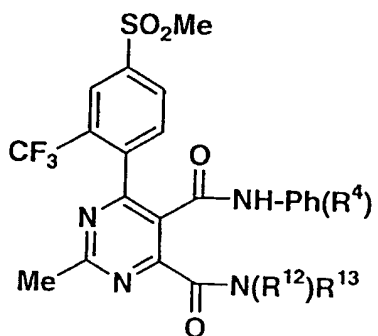
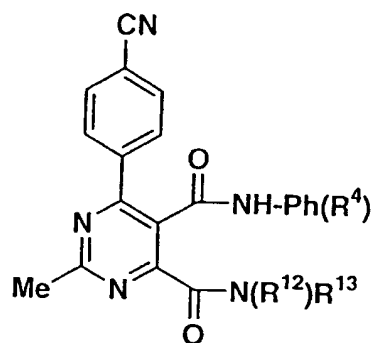
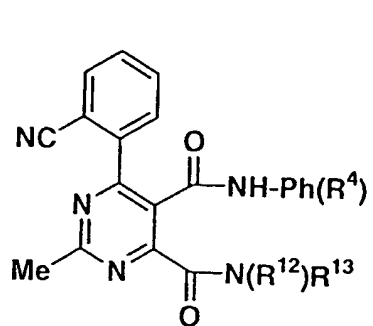
R ¹²	R ¹³
(CH ₂) ₂ OH	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ OMe	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ OEt	CH ₂ CH=CH ₂
(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ CH=CH ₂
(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ CH=CH ₂
(CH ₂) ₃ OMe	CH ₂ CH=CH ₂
(CH ₂) ₃ OEt	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ SMe	CH ₂ CH=CH ₂
CN	CH ₂ CH=CH ₂
Ph	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ Ph (4-OMe)	CH ₂ CH=CH ₂
CH(Me)Ph	CH ₂ CH=CH ₂
(CH ₂) ₂ Ph	CH ₂ CH=CH ₂
CH=CHPh	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ CH=CHPh	CH ₂ CH=CH ₂
C≡CPh	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ C≡CPh	CH ₂ CH=CH ₂
G(a)	CH ₂ CH=CH ₂
G(b)	CH ₂ CH=CH ₂
G(c)	CH ₂ CH=CH ₂
G(d)	CH ₂ CH=CH ₂
- (CH ₂) ₃ -	
- (CH ₂) ₄ -	

表 7 5

R^{12}	R^{13}
— (CH ₂) ₅ —	
— (CH ₂) ₆ —	
— (CH ₂) ₇ —	
— (CH ₂) ₂ —O— (CH ₂) ₂ —	
— (CH ₂) ₂ —S— (CH ₂) ₂ —	

〔第 1 2 表〕



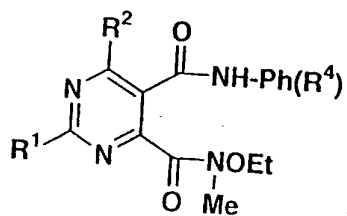
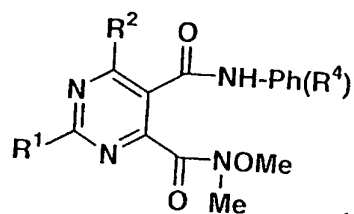
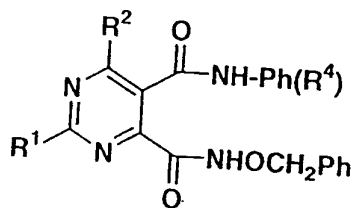
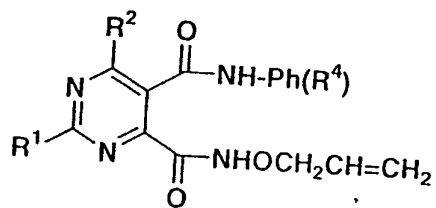
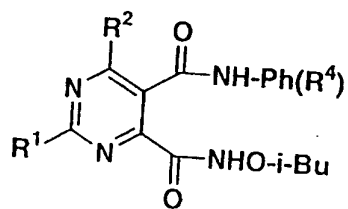
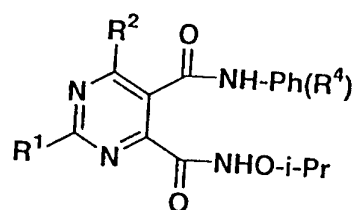
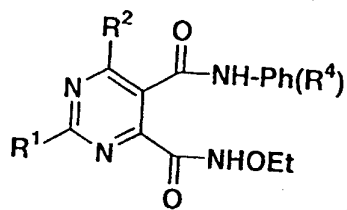
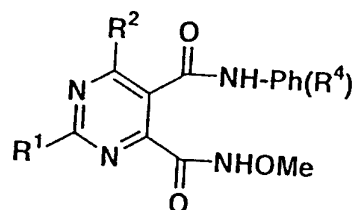
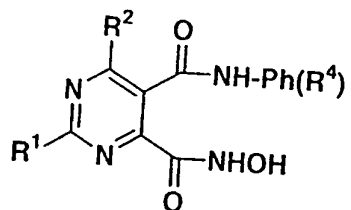


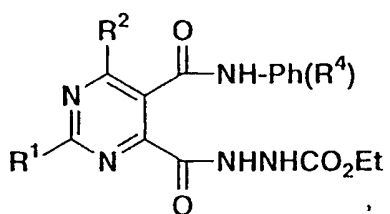
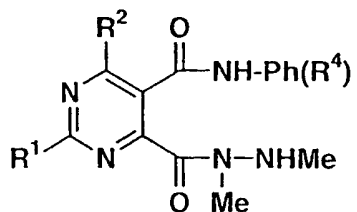
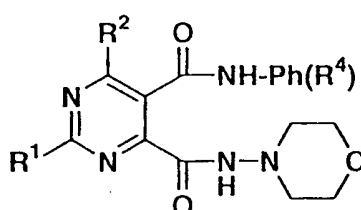
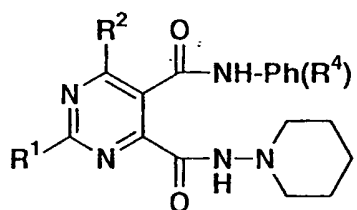
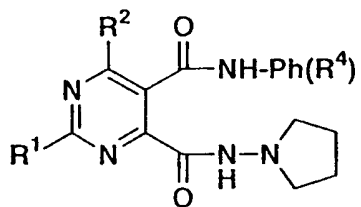
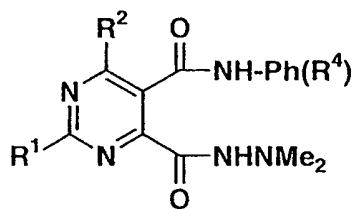
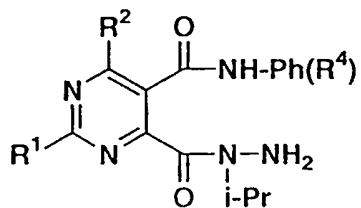
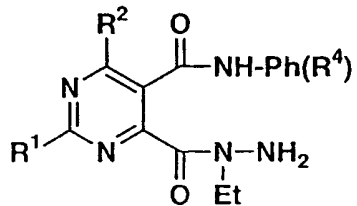
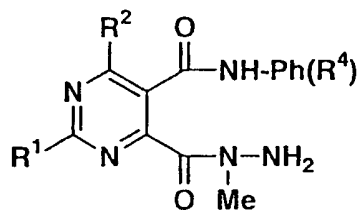
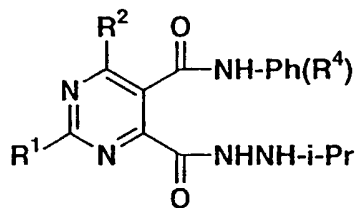
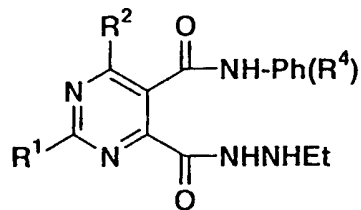
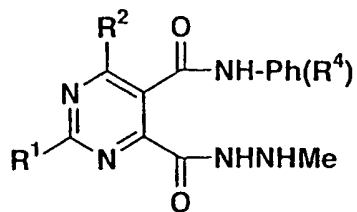
or

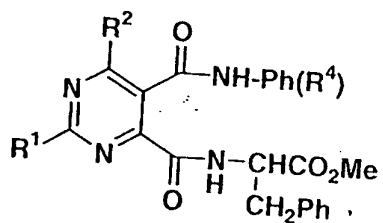
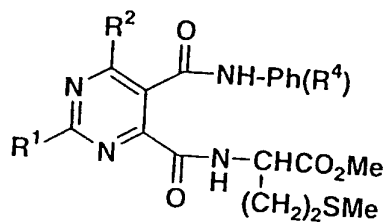
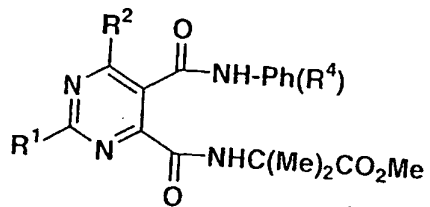
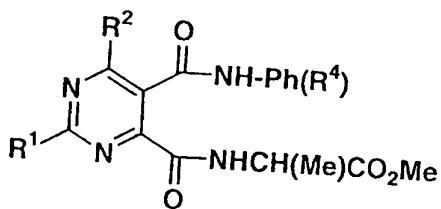
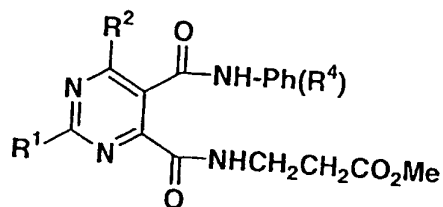
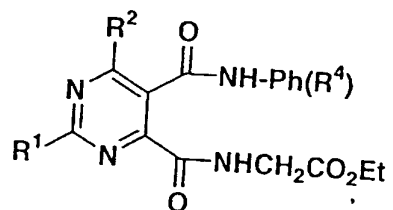
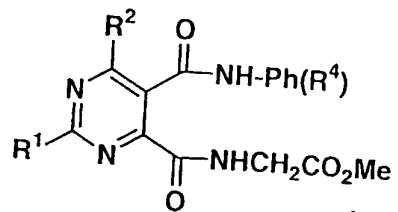
表 7 6

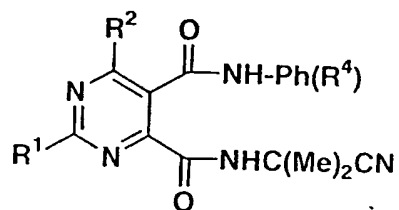
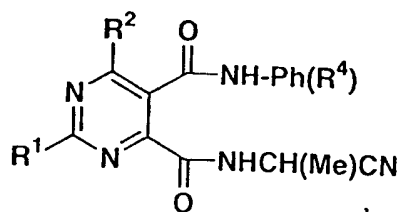
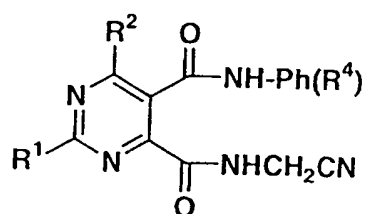
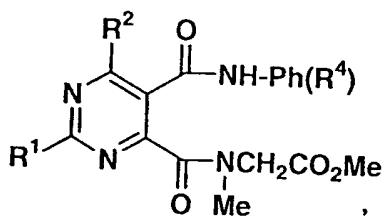
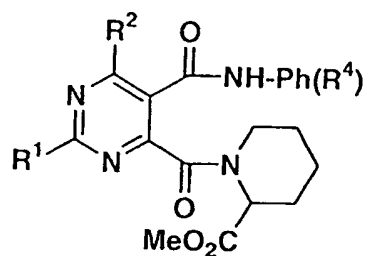
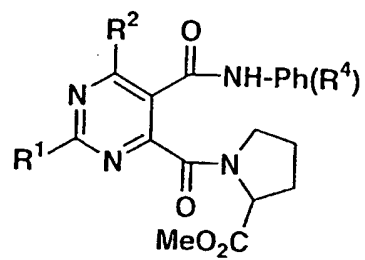
R ¹²	R ¹³
E t	H
P r	H
i - P r	H
B u	H
s - B u	H
i - B u	H
t - B u	H
P e n	H
H e x	H
CH ₂ CH=CH ₂	H
CH ₂ C≡CH	H
CH (M e) C≡CH	H
C (M e) ₂ C≡CH	H
(CH ₂) ₂ C≡CH	H
c - P r	H
c - P e n	H
c - H e x	H
- (CH ₂) ₃ -	
- (CH ₂) ₄ -	
- (CH ₂) ₅ -	
- (CH ₂) ₆ -	
- (CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	
- (CH ₂) ₂ -S-(CH ₂) ₂ -	

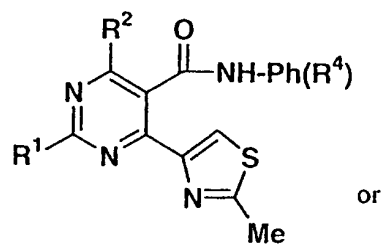
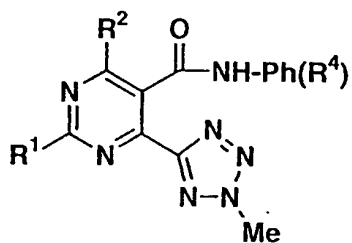
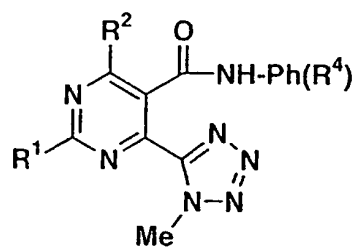
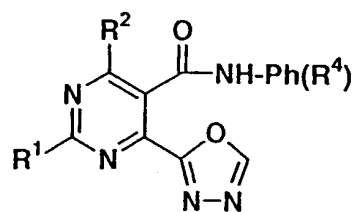
〔第 13 表〕











or

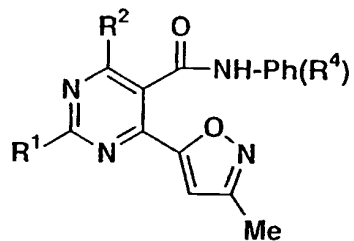


表 7 7

R ¹	R ²
H	H
Me	H
Et	H
CF ₃	H
CF ₃ CH ₂	H
MeO	H
EtO	H
CHF ₂ O	H
MeS	H
EtS	H
Me ₂ N	H
CN	H
MeOCH ₂	H
MeSCH ₂	H
H	Me
Me	Me
Et	Me
CF ₃	Me
CF ₃ CH ₂	Me
MeO	Me
EtO	Me
CHF ₂ O	Me
MeS	Me

表 7 8

R ¹	R ²
Et S	Me
Me ₂ N	Me
CN	Me
Me OCH ₂	Me
Me SCH ₂	Me

〔第 1 4 表〕

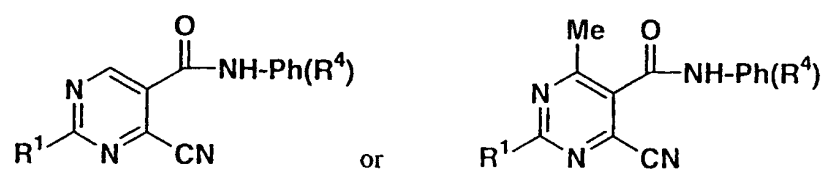
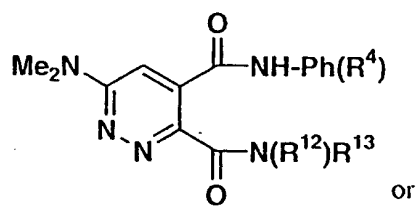
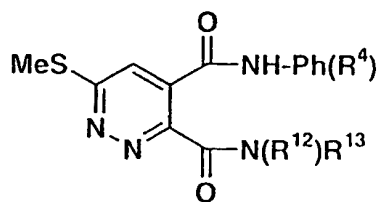
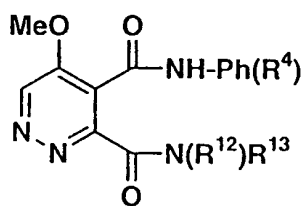
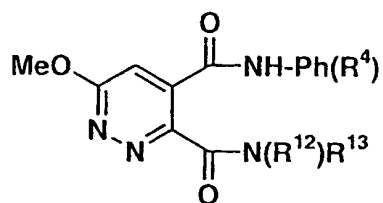
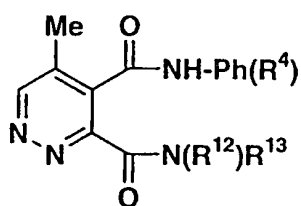
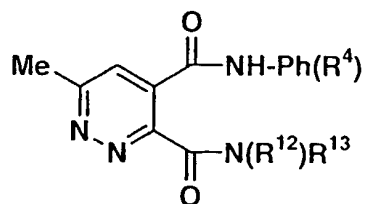
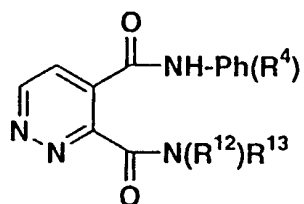


表 7 9

R ¹
H、Me、Et、MeO、EtO、MeS、EtS、Me ₂ N、CF ₃ 、CN

[第 15 表]



or

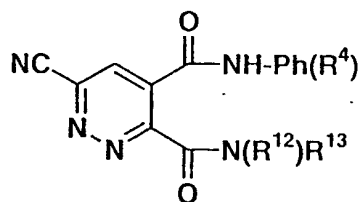


表 8 0

R ¹²	R ¹³
H	H
Me	H
Et	H
Pr	H
i-Pr	H
Bu	H
s-Bu	H
i-Bu	H
t-Bu	H
Pen	H
Hex	H
Hep	H
CH ₂ CH=CH ₂	H
CH ₂ C(Me)=CH ₂	H
CH ₂ CH=CHMe	H
CH ₂ CH=CMe ₂	H
CH(Me)CH=CH ₂	H
C(Me) ₂ CH=CH ₂	H
CH ₂ C≡CH	H
CH ₂ C≡CMe	H
CH(Me)C≡CH	H
C(Me) ₂ C≡CH	H
(CH ₂) ₂ C≡CH	H

表 8 1

R ¹²	R ¹³
CH ₂ CF ₃	H
(CH ₂) ₂ Cl	H
(CH ₂) ₃ Cl	H
(CH ₂) ₃ Br	H
(CH ₂) ₃ F	H
CH ₂ CH=CHCl	H
CH ₂ CH=CCl ₂	H
c-Pr	H
c-Bu	H
c-Pen	H
c-Hex	H
c-Hep	H
CH ₂ OH	H
(CH ₂) ₂ OH	H
CH ₂ OMe	H
CH ₂ OEt	H
(CH ₂) ₂ OMe	H
(CH ₂) ₂ OEt	H
(CH ₂) ₃ OMe	H
(CH ₂) ₃ OEt	H
CH ₂ SMe	H
CN	H
Ph	H

表 8 2

R ¹²	R ¹³
CH ₂ Ph (4-OMe)	H
CH (Me) Ph	H
(CH ₂) ₂ Ph	H
CH=CHPh	H
CH ₂ CH=CHPh	H
C≡CPh	H
CH ₂ C≡CPh	H
G (a)	H
G (b)	H
G (c)	H
G (d)	H
Me	Me
Et	Me
Pr	Me
i-Pr	Me
Bu	Me
s-Bu	Me
i-Bu	Me
t-Bu	Me
Pen	Me
Hex	Me
Hep	Me

表 8 3

R^{12}	R^{13}
$CH_2CH=CH_2$	Me
$CH_2C(Me)=CH_2$	Me
$CH_2CH=CHMe$	Me
$CH_2CH=CMe_2$	Me
$CH(Me)CH=CH_2$	Me
$C(Me)_2CH=CH_2$	Me
$CH_2C\equiv CH$	Me
$CH_2C\equiv CMe$	Me
$CH(Me)C\equiv CH$	Me
$C(Me)_2C\equiv CH$	Me
$(CH_2)_2C\equiv CH$	Me
CH_2CF_3	Me
$(CH_2)_2Cl$	Me
$(CH_2)_3Cl$	Me
$(CH_2)_3Br$	Me
$(CH_2)_3F$	Me
$CH_2CH=CHCl$	Me
$CH_2CH=CCl_2$	Me
c-Pr	Me
c-Bu	Me
c-Pen	Me
c-Hex	Me
c-Hept	Me

表 8 4

R^{12}	R^{13}
CH_2OH	Me
$(CH_2)_2OH$	Me
CH_2OMe	Me
CH_2OEt	Me
$(CH_2)_2OMe$	Me
$(CH_2)_2OEt$	Me
$(CH_2)_3OMe$	Me
$(CH_2)_3OEt$	Me
CH_2SMe	Me
CN	Me
Ph	Me
CH_2Ph (4-OMe)	Me
$CH(Me)Ph$	Me
$(CH_2)_2Ph$	Me
$CH=CHPh$	Me
$CH_2CH=CHPh$	Me
$C\equiv CPh$	Me
$CH_2C\equiv CPh$	Me
G (a)	Me
G (b)	Me
G (c)	Me
G (d)	Me

表 8 5

R^{12}	R^{13}
E t	E t
P r	E t
i - P r	E t
B u	E t
s - B u	E t
i - B u	E t
t - B u	E t
P e n	E t
H e x	E t
H e p	E t
$CH_2CH=CH_2$	E t
$CH_2C(Me)=CH_2$	E t
$CH_2CH=CHMe$	E t
$CH_2CH=CM e_2$	E t
$CH(Me)CH=CH_2$	E t
$C(Me)_2CH=CH_2$	E t
$CH_2C\equiv CH$	E t
$CH_2C\equiv CMe$	E t
$CH(Me)C\equiv CH$	E t
$C(Me)_2C\equiv CH$	E t
$(CH_2)_2C\equiv CH$	E t
CH_2CF_3	E t

表 8 6

R ¹²	R ¹³
(CH ₂) ₂ Cl	Et
(CH ₂) ₃ Cl	Et
(CH ₂) ₃ Br	Et
(CH ₂) ₃ F	Et
CH ₂ CH=CHCl	Et
CH ₂ CH=CCl ₂	Et
c-Pr	Et
c-Bu	Et
c-Pen	Et
c-Hex	Et
c-Hep	Et
CH ₂ OH	Et
(CH ₂) ₂ OH	Et
CH ₂ OMe	Et
CH ₂ OEt	Et
(CH ₂) ₂ OMe	Et
(CH ₂) ₂ OEt	Et
(CH ₂) ₃ OMe	Et
(CH ₂) ₃ OEt	Et
CH ₂ SMe	Et
CN	Et
Ph	Et
CH ₂ Ph (4-OMe)	Et

表 8 7

R^{12}	R^{13}
CH (Me) Ph	Et
(CH ₂) ₂ Ph	Et
CH=CHPh	Et
CH ₂ CH=CHPh	Et
C≡CPh	Et
CH ₂ C≡CPh	Et
G (a)	Et
G (b)	Et
G (c)	Et
G (d)	Et
Pr	CH ₂ CH=CH ₂
i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂
Bu	CH ₂ CH=CH ₂
s-Bu	CH ₂ CH=CH ₂
i-Bu	CH ₂ CH=CH ₂
t-Bu	CH ₂ CH=CH ₂
Pen	CH ₂ CH=CH ₂
Hex	CH ₂ CH=CH ₂
Hep	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂

表 8 8

R ¹²	R ¹³
CH ₂ C (Me) = CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ CH=CHMe	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ CH=CM e ₂	CH ₂ CH=CH ₂
CH (Me) CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
C (Me) ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ C≡CMe	CH ₂ CH=CH ₂
CH (Me) C≡CH	CH ₂ CH=CH ₂
C (Me) ₂ C≡CH	CH ₂ CH=CH ₂
(CH ₂) ₂ C≡CH	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂
(CH ₂) ₂ Cl	CH ₂ CH=CH ₂
(CH ₂) ₃ Cl	CH ₂ CH=CH ₂
(CH ₂) ₃ Br	CH ₂ CH=CH ₂
(CH ₂) ₃ F	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ CH=CHCl	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ CH=CCl ₂	CH ₂ CH=CH ₂
c-Pr	CH ₂ CH=CH ₂
c-Bu	CH ₂ CH=CH ₂
c-Pen	CH ₂ CH=CH ₂
c-Hex	CH ₂ CH=CH ₂
c-Hep	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ OH	CH ₂ CH=CH ₂

表 8 9

R ¹²	R ¹³
(CH ₂) ₂ OH	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ OMe	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ OEt	CH ₂ CH=CH ₂
(CH ₂) ₂ OMe	CH ₂ CH=CH ₂
(CH ₂) ₂ OEt	CH ₂ CH=CH ₂
(CH ₂) ₃ OMe	CH ₂ CH=CH ₂
(CH ₂) ₃ OEt	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ SMe	CH ₂ CH=CH ₂
CN	CH ₂ CH=CH ₂
Ph	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ Ph (4-OMe)	CH ₂ CH=CH ₂
CH(Me)Ph	CH ₂ CH=CH ₂
(CH ₂) ₂ Ph	CH ₂ CH=CH ₂
CH=CHPh	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ CH=CHPh	CH ₂ CH=CH ₂
C≡CPh	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ C≡CPh	CH ₂ CH=CH ₂
G(a)	CH ₂ CH=CH ₂
G(b)	CH ₂ CH=CH ₂
G(c)	CH ₂ CH=CH ₂
G(d)	CH ₂ CH=CH ₂
H	COMe
Me	COMe

表 9 0

R ¹²	R ¹³
E t	C O M e
P r	C O M e
i - P r	C O M e
B u	C O M e
s - B u	C O M e
i - B u	C O M e
t - B u	C O M e
P e n	C O M e
H e x	C O M e
H e p	C O M e
C H ₂ C H = C H ₂	C O M e
C H ₂ C (M e) = C H ₂	C O M e
C H ₂ C H = C H M e	C O M e
C H ₂ C H = C M e ₂	C O M e
C H (M e) C H = C H ₂	C O M e
C (M e) ₂ C H = C H ₂	C O M e
C H ₂ C ≡ C H	C O M e
C H ₂ C ≡ C M e	C O M e
C H (M e) C ≡ C H	C O M e
C (M e) ₂ C ≡ C H	C O M e
(C H ₂) ₂ C ≡ C H	C O M e
C H ₂ C F ₃	C O M e
(C H ₂) ₂ C I	C O M e

表 9 1

R ¹²	R ¹³
(CH ₂) ₃ Cl	COMe
(CH ₂) ₃ Br	COMe
(CH ₂) ₃ F	COMe
CH ₂ CH=CHCl	COMe
CH ₂ CH=CCl ₂	COMe
c-Pr	COMe
c-Bu	COMe
c-Pen	COMe
c-Hex	COMe
c-Hep	COMe
CH ₂ OH	COMe
(CH ₂) ₂ OH	COMe
CH ₂ OMe	COMe
CH ₂ OEt	COMe
(CH ₂) ₂ OMe	COMe
(CH ₂) ₂ OEt	COMe
(CH ₂) ₃ OMe	COMe
(CH ₂) ₃ OEt	COMe
CH ₂ SMe	COMe
CN	COMe
Ph	COMe
CH ₂ Ph (4-OMe)	COMe
CH(Me)Ph	COMe

表 9 2

R ¹²	R ¹³
(CH ₂) ₂ Ph	COMe
CH=CHPh	COMe
CH ₂ CH=CHPh	COMe
C≡CPh	COMe
CH ₂ C≡CPh	COMe
G (a)	COMe
G (b)	COMe
G (c)	COMe
G (d)	COMe
H	CO-t-Bu
Me	CO-t-Bu
Et	CO-t-Bu
Pr	CO-t-Bu
i-Pr	CO-t-Bu
Bu	CO-t-Bu
s-Bu	CO-t-Bu
i-Bu	CO-t-Bu
t-Bu	CO-t-Bu
Pen	CO-t-Bu
Hex	CO-t-Bu
Hep	CO-t-Bu
CH ₂ CH=CH ₂	CO-t-Bu
CH ₂ C(Me)=CH ₂	CO-t-Bu

表 9 3

R ¹²	R ¹³
CH ₂ CH=CHMe	CO-t-Bu
CH ₂ CH=CM _{e2}	CO-t-Bu
CH(Me)CH=CH ₂	CO-t-Bu
C(Me) ₂ CH=CH ₂	CO-t-Bu
CH ₂ C≡CH	CO-t-Bu
CH ₂ C≡CMe	CO-t-Bu
CH(Me)C≡CH	CO-t-Bu
C(Me) ₂ C≡CH	CO-t-Bu
(CH ₂) ₂ C≡CH	CO-t-Bu
CH ₂ CF ₃	CO-t-Bu
(CH ₂) ₂ Cl	CO-t-Bu
(CH ₂) ₃ Cl	CO-t-Bu
(CH ₂) ₃ Br	CO-t-Bu
(CH ₂) ₃ F	CO-t-Bu
CH ₂ CH=CHCl	CO-t-Bu
CH ₂ CH=CCl ₂	CO-t-Bu
c-Pr	CO-t-Bu
c-Bu	CO-t-Bu
c-Pen	CO-t-Bu
c-Hex	CO-t-Bu
c-Hep	CO-t-Bu
CH ₂ OH	CO-t-Bu
(CH ₂) ₂ OH	CO-t-Bu

表 9 4

R ¹²	R ¹³
CH ₂ OMe	CO-t-Bu
CH ₂ OEt	CO-t-Bu
(CH ₂) ₂ OMe	CO-t-Bu
(CH ₂) ₂ OEt	CO-t-Bu
(CH ₂) ₃ OMe	CO-t-Bu
(CH ₂) ₃ OEt	CO-t-Bu
CH ₂ SMe	CO-t-Bu
CN	CO-t-Bu
Ph	CO-t-Bu
CH ₂ Ph (4-OMe)	CO-t-Bu
CH(Me)Ph	CO-t-Bu
(CH ₂) ₂ Ph	CO-t-Bu
CH=CHPh	CO-t-Bu
CH ₂ CH=CHPh	CO-t-Bu
C≡CPh	CO-t-Bu
CH ₂ C≡CPh	CO-t-Bu
G(a)	CO-t-Bu
G(b)	CO-t-Bu
G(c)	CO-t-Bu
G(d)	CO-t-Bu
H	COPh (4-OMe)
Me	COPh (4-OMe)
Et	COPh (4-OMe)

表 9 5

R ¹²	R ¹³
P r	C O P h (4 - O M e)
i - P r	C O P h (4 - O M e)
B u	C O P h (4 - O M e)
s - B u	C O P h (4 - O M e)
i - B u	C O P h (4 - O M e)
t - B u	C O P h (4 - O M e)
P e n	C O P h (4 - O M e)
H e x	C O P h (4 - O M e)
H e p	C O P h (4 - O M e)
C H ₂ C H = C H ₂	C O P h (4 - O M e)
C H ₂ C (M e) = C H ₂	C O P h (4 - O M e)
C H ₂ C H = C H M e	C O P h (4 - O M e)
C H ₂ C H = C M e ₂	C O P h (4 - O M e)
C H (M e) C H = C H ₂	C O P h (4 - O M e)
C (M e) ₂ C H = C H ₂	C O P h (4 - O M e)
C H ₂ C ≡ C H	C O P h (4 - O M e)
C H ₂ C ≡ C M e	C O P h (4 - O M e)
C H (M e) C ≡ C H	C O P h (4 - O M e)
C (M e) ₂ C ≡ C H	C O P h (4 - O M e)
(C H ₂) ₂ C ≡ C H	C O P h (4 - O M e)
C H ₂ C F ₃	C O P h (4 - O M e)
(C H ₂) ₂ C l	C O P h (4 - O M e)
(C H ₂) ₃ C l	C O P h (4 - O M e)

表 9 6

R ¹²	R ¹³
(CH ₂) ₃ Br	COPh (4-OMe)
(CH ₂) ₃ F	COPh (4-OMe)
CH ₂ CH=CHCl	COPh (4-OMe)
CH ₂ CH=CCl ₂	COPh (4-OMe)
c-Pr	COPh (4-OMe)
c-Bu	COPh (4-OMe)
c-Pen	COPh (4-OMe)
c-Hex	COPh (4-OMe)
c-Hept	COPh (4-OMe)
CH ₂ OH	COPh (4-OMe)
(CH ₂) ₂ OH	COPh (4-OMe)
CH ₂ OMe	COPh (4-OMe)
CH ₂ OEt	COPh (4-OMe)
(CH ₂) ₂ OMe	COPh (4-OMe)
(CH ₂) ₂ OEt	COPh (4-OMe)
(CH ₂) ₃ OMe	COPh (4-OMe)
(CH ₂) ₃ OEt	COPh (4-OMe)
CH ₂ SMe	COPh (4-OMe)
CN	COPh (4-OMe)
Ph	COPh (4-OMe)
CH ₂ Ph (4-OMe)	COPh (4-OMe)
CH(Me)Ph	COPh (4-OMe)
(CH ₂) ₂ Ph	COPh (4-OMe)

表 9 7

R ¹²	R ¹³
CH=CHPh	COPh (4-OMe)
CH ₂ CH=CHPh	COPh (4-OMe)
C≡CPh	COPh (4-OMe)
CH ₂ C≡CPh	COPh (4-OMe)
G (a)	COPh (4-OMe)
G (b)	COPh (4-OMe)
G (c)	COPh (4-OMe)
G (d)	COPh (4-OMe)
H	CO ₂ Me
Me	CO ₂ Me
Et	CO ₂ Me
Pr	CO ₂ Me
i-Pr	CO ₂ Me
Bu	CO ₂ Me
s-Bu	CO ₂ Me
i-Bu	CO ₂ Me
t-Bu	CO ₂ Me
Pen	CO ₂ Me
Hex	CO ₂ Me
Hep	CO ₂ Me
CH ₂ CH=CH ₂	CO ₂ Me
CH ₂ C (Me) =CH ₂	CO ₂ Me
CH ₂ CH=CHMe	CO ₂ Me

表 9 8

R^{12}	R^{13}
$CH_2CH=CHMe_2$	CO_2Me
$CH(Me)CH=CH_2$	CO_2Me
$C(Me)_2CH=CH_2$	CO_2Me
$CH_2C\equiv CH$	CO_2Me
$CH_2C\equiv CMe$	CO_2Me
$CH(Me)C\equiv CH$	CO_2Me
$C(Me)_2C\equiv CH$	CO_2Me
$(CH_2)_2C\equiv CH$	CO_2Me
CH_2CF_3	CO_2Me
$(CH_2)_2Cl$	CO_2Me
$(CH_2)_3Cl$	CO_2Me
$(CH_2)_3Br$	CO_2Me
$(CH_2)_3F$	CO_2Me
$CH_2CH=CHCl$	CO_2Me
$CH_2CH=CCl_2$	CO_2Me
$c-Pr$	CO_2Me
$c-Bu$	CO_2Me
$c-Pen$	CO_2Me
$c-Hex$	CO_2Me
$c-Hep$	CO_2Me
CH_2OH	CO_2Me
$(CH_2)_2OH$	CO_2Me
CH_2OMe	CO_2Me

表 9 9

R ¹²	R ¹³
CH ₂ OE t	CO ₂ Me
(CH ₂) ₂ OMe	CO ₂ Me
(CH ₂) ₂ OE t	CO ₂ Me
(CH ₂) ₃ OMe	CO ₂ Me
(CH ₂) ₃ OE t	CO ₂ Me
CH ₂ SMe	CO ₂ Me
CN	CO ₂ Me
Ph	CO ₂ Me
CH ₂ Ph (4-OMe)	CO ₂ Me
CH(Me)Ph	CO ₂ Me
(CH ₂) ₂ Ph	CO ₂ Me
CH=CHPh	CO ₂ Me
CH ₂ CH=CHPh	CO ₂ Me
C≡CPh	CO ₂ Me
CH ₂ C≡CPh	CO ₂ Me
G(a)	CO ₂ Me
G(b)	CO ₂ Me
G(c)	CO ₂ Me
G(d)	CO ₂ Me
H	SO ₂ Me
Me	SO ₂ Me
Et	SO ₂ Me
Pr	SO ₂ Me

表 1 0 0

R ¹²	R ¹³
i - P r	S O ₂ M e
B u	S O ₂ M e
s - B u	S O ₂ M e
i - B u	S O ₂ M e
t - B u	S O ₂ M e
P e n	S O ₂ M e
H e x	S O ₂ M e
H e p	S O ₂ M e
CH ₂ CH=CH ₂	S O ₂ M e
CH ₂ C (M e) =CH ₂	S O ₂ M e
CH ₂ CH=CHM e	S O ₂ M e
CH ₂ CH=CM e ₂	S O ₂ M e
CH (M e) CH=CH ₂	S O ₂ M e
C (M e) ₂ CH=CH ₂	S O ₂ M e
CH ₂ C≡CH	S O ₂ M e
CH ₂ C≡CM e	S O ₂ M e
CH (M e) C≡CH	S O ₂ M e
C (M e) ₂ C≡CH	S O ₂ M e
(CH ₂) ₂ C≡CH	S O ₂ M e
CH ₂ CF ₃	S O ₂ M e
(CH ₂) ₂ Cl	S O ₂ M e
(CH ₂) ₃ Cl	S O ₂ M e
(CH ₂) ₃ Br	S O ₂ M e

表 101

R ¹²	R ¹³
(CH ₂) ₃ F	SO ₂ Me
CH ₂ CH=CHCl	SO ₂ Me
CH ₂ CH=CCl ₂	SO ₂ Me
c-Pr	SO ₂ Me
c-Bu	SO ₂ Me
c-Pen	SO ₂ Me
c-Hex	SO ₂ Me
c-Hep	SO ₂ Me
CH ₂ OH	SO ₂ Me
(CH ₂) ₂ OH	SO ₂ Me
CH ₂ OMe	SO ₂ Me
CH ₂ OEt	SO ₂ Me
(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
(CH ₂) ₂ OEt	SO ₂ Me
(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
(CH ₂) ₃ OEt	SO ₂ Me
CH ₂ SMe	SO ₂ Me
CN	SO ₂ Me
Ph	SO ₂ Me
CH ₂ Ph (4-OMe)	SO ₂ Me
CH(Me)Ph	SO ₂ Me
(CH ₂) ₂ Ph	SO ₂ Me
CH=CHPh	SO ₂ Me

表 102

R ¹²	R ¹³
CH ₂ CH=CHPh	SO ₂ Me
C≡CPh	SO ₂ Me
CH ₂ C≡CPh	SO ₂ Me
G (a)	SO ₂ Me
G (b)	SO ₂ Me
G (c)	SO ₂ Me
G (d)	SO ₂ Me

〔第 16 表〕

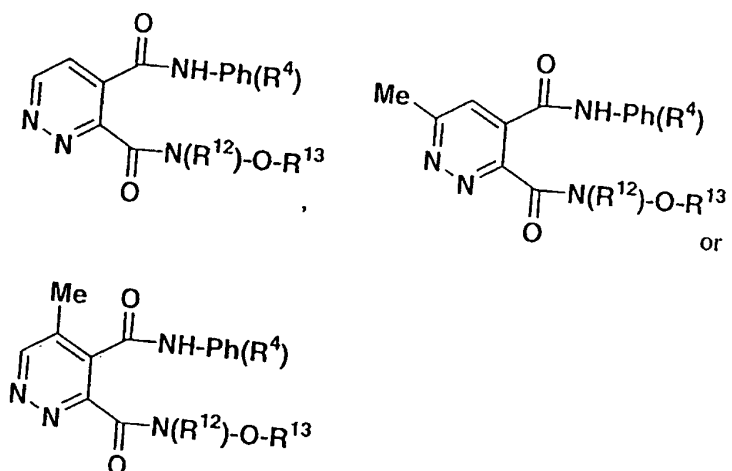


表 1 0 3

R^{12}	R^{13}
H	H
H	Me
H	Et
H	i-Pr
H	i-Bu
H	$CH_2CH=CH_2$
H	CH_2Ph
Me	Me
Me	Et

〔第 1 7 表〕

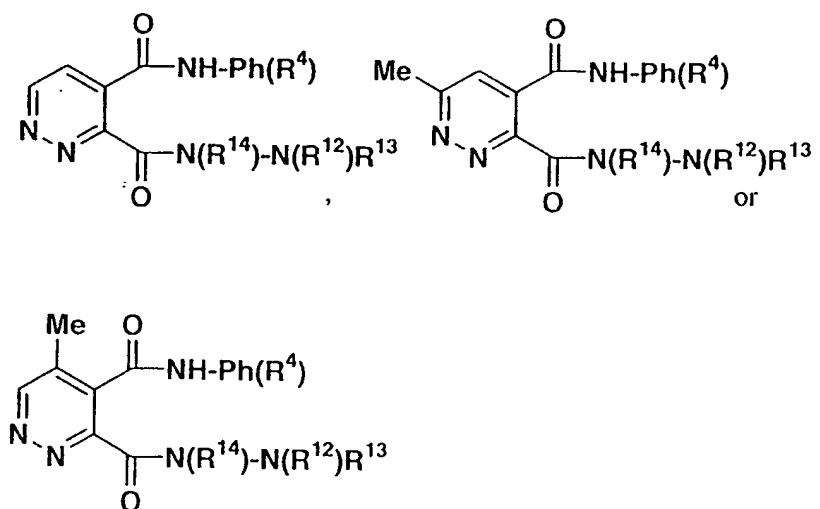


表 104

R ¹²	R ¹³	R ¹⁴
Me	H	H
Et	H	H
i-Pr	H	H
H	H	Me
H	H	Et
H	H	i-Pr
Me	Me	H
-(CH ₂) ₄ -		H
-(CH ₂) ₅ -		H
-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		H
Me	H	Me
CO ₂ Et	H	H

第9表～第17表中、「c-」とあるのはシクロを、「i-」とあるのはイソを、「s-」とあるのはセカンダリーを、「t-」はとあるのはターシャリーを、Meはメチル基を、Etはエチル基を、Prはプロピル基を、Buはブチル基を、Penはペンチル基を、Hexはヘキシル基を、Hepはヘプチル基を、Phはフェニル基をそれぞれ表わす。また、G(a)、G(b)、G(c)及びG(d)は、それぞれ前述の構造を表わす。

本発明化合物のあるものは畑地、非耕地用除草剤として、土壌処理、茎葉処理のいずれの処理方法に於いても、イヌホウズキ (*Solanum nigrum*)、チョウセンアサガオ (*Datura stramonium*)等に代表されるナス科 (*Solanaceae*) 雑草、イチビ (*Abutilon theophrasti*)、アメリカキンゴジカ (*Sida spinosa*) 等に代表されるアオイ科 (*Malvaceae*) 雑草、マルバアサガオ (*Ipomoea purpurea*) 等のアサガオ類 (*Ipomoea* spp.) やヒルガオ類 (*Calystegia* spp.) 等に代表されるヒル

ガオ科 (Convolvulaceae) 雑草、イヌビユ (Amaranthus lividus)、アオビユ (Amaranthus retroflexus) 等に代表されるヒユ科 (Amaranthaceae) 雑草、オナモミ (Xanthium pensylvanicum)、ブタクサ (Ambrosia artemisiaefolia)、ヒマワリ (Helianthus annuus)、ハキダメギク (Galinsoga ciliata)、セイヨウトゲアザミ (Cirsium arvense)、ノボロギク (Senecio vulgaris)、ヒメジョオン (Erigeron annuus) 等に代表されるキク科 (Compositae) 雑草、イヌガラシ (Rorippa indica)、ノハラガラシ (Sinapis arvensis)、ナズナ (Capsella Bursa pastoris) 等に代表されるアブラナ科 (Cruciferae) 雑草、イヌタデ (Polygonum Blumei)、ソバカズラ (Polygonum convolvulus) 等に代表されるタデ科 (Polygonaceae) 雑草、スベリヒユ (Portulaca oleracea) 等に代表されるスベリヒユ科 (Portulacaceae) 雑草、シロザ (Chenopodium album)、コアカザ (Chenopodium ficifolium)、ホウキギ (Kochia scoparia) 等に代表されるアカザ科 (Chenopodiaceae) 雑草、ハコベ (Stellaria media) 等に代表されるナデシコ科 (Caryophyllaceae) 雑草、オオイヌノフグリ (Veronica persica) 等に代表されるゴマノハグサ科 (Scrophulariaceae) 雑草、ツユクサ (Commelina communis) 等に代表されるツユクサ科 (Commelinaceae) 雑草、ホトケノザ (Lamium amplexicaule)、ヒメオドリコソウ (Lamium purpureum) 等に代表されるシソ科 (Labiatae) 雑草、コニシキソウ (Euphorbia supina)、オオニシキソウ (Euphorbia maculata) 等に代表されるトウダイグサ科 (Euphorbiaceae) 雑草、ヤエムグラ (Galium spurium)、アカネ (Rubia akane) 等に代表されるアカネ科 (Rubiaceae) 雑草、スミレ (Viola mandshurica) 等に代表されるスミレ科 (Violaceae) 雑草、アメリカツノクサネム (Sesbania exaltata)、エビスグサ (Cassia obtusifolia) 等に代表されるマメ科 (Leguminosae) 雑草等の広葉雑草 (Broad leaved weeds)、野生ソルガム (Sorghum bicolor)、オオクサキビ (Panicum dichotomiflorum)、ジョンソングラス (Sorghum halepense)、イヌビエ (Echinochloa crus galli var. crus galli)、ヒメイヌビエ (Echinochloa crus galli var. praticola)、栽培ビエ (Echinochloa utilis)、メヒシバ (Digitaria adscendens)、カラスムギ (Avanafatua)、オヒシバ (Eleusine indica)、エノコログサ (Setaria viridis)、スズメノテッポウ (Alopecurus aequalis) 等に代表されるイネ科雑草 (Graminac

eous weeds)、ハマスゲ (Cyperus rotundus, Cyperus esculentus) 等に代表されるカヤツリグサ科雑草 (Cyperaceous weeds) 等の各種畑地雑草 (Cropland weeds) に低薬量で高い殺草力を有する。

又、水田用除草剤として湛水下の土壌処理及び茎葉処理のいずれの処理方法に於いても、ヘラオモダカ (Alisma canaliculatum)、オモダカ (Sagittaria trifolia)、ウリカワ (Sagittaria pygmaea) 等に代表されるオモダカ科 (Alismataceae) 雑草、タマガヤツリ (Cyperus difformis)、ミズガヤツリ (Cyperus serotinus)、ホタルイ (Scirpus juncoides)、クログワイ (Eleocharis kuroguwai) 等に代表されるカヤツリグサ科 (Cyperaceae) 雑草、アゼナ (Lindernia pyxidaria) 等に代表されるゴマノハグサ科 (Scrophulariaceae) 雑草、コナギ (Monochoria vaginalis) 等に代表されるミズアオイ科 (Potamogetonaceae) 雑草、ヒルムシロ (Potamogeton distinctus) 等に代表されるヒルムシロ科 (Potamogetonaceae) 雑草、キカシグサ (Rotala indica) 等に代表されるミソハギ科 (Lythraceae) 雑草、タイヌビエ (Echinochloa oryzicola)、ヒメタイヌビエ (Echinochloa crus galli var. formosensis)、イヌビエ (Echinochloa crus galli var. crus galli) 雑草等、各種、水田雑草 (Paddy weeds) に低薬量で高い殺草力を有する。

さらに本発明化合物のあるものは、重要作物であるイネ、コムギ、オオムギ、ソルゴー、落花生、トウモロコシ、大豆、棉、ビート等に対して高い安全性を有する。

本発明化合物を除草剤として施用するにあたっては、一般には適当な担体、例えばクレー、タルク、ベントナイト、尿素、硫酸アンモニウム、クルミ粉、珪藻土、ホワイトカーボン等の固体担体あるいは水、アルコール類 (イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコール、ベンジルアルコール、フルフリルアルコール等)、芳香族炭化水素類 (トルエン、キシレン、メチルナフタレン等)、エーテル類 (アニソール等)、植物油 (大豆油、綿実油等)、ケトン類 (シクロヘキサノン、イソホロン等)、エステル類 (酢酸ブチル等)、酸アミド類 (N-メチルピロリドン等) 又はハロゲン化炭化水素類 (クロロベンゼン等) などの液体担体と混用して適用することができ、所望により界面活性剤、乳化剤、分散剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、固結防止剤、安定剤などを添加し、液剤、

乳剤、水和剤、ドライフロアブル剤、フロアブル剤、粉剤、粉剤等任意の剤型にて実用に供することが出来る。

また、本発明化合物は必要に応じて製剤又は散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤などと混合施用してもよい。

特に他の農薬と混合施用することにより、施用薬量の減少による低コスト化、混合薬剤の相乗作用によるスペクトラムの拡大や、より高い除草効果が期待出来る。この際、同時に複数の公知農薬との組み合わせも可能である。本発明化合物と混合使用する農薬の種類としては、例えば、ファーム・ケミカルズ・ハンドブック (Farm Chemicals Handbook) 1998年版に記載されている化合物などがある。

本発明化合物の施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、気象条件、製剤形態、土壌条件、栽培作物等により差異はあるが一般には有効成分量としてヘクタール (ha) 当たり 0.0001 ~ 10 kg 程度、好ましくは 0.001 ~ 5 kg 程度が適当である。

次に具体的に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

本発明化合物を使用するにあたっては、通常適当な固体担体又は液体担体と混合し、更に所望により界面活性剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、結合剤、固結防止剤、崩壊剤、消泡剤、防腐剤及び分解防止剤等を添加して、液剤、乳剤、水和剤、水溶剤、顆粒水和剤、顆粒水溶剤、懸濁剤、乳濁剤、サスポエマルジョン、マイクロエマルジョン、粉剤、粒剤及びゲル剤等任意の剤型の製剤にて実用に供することが出来る。また、省力化及び安全性向上の観点から、上記任意の剤型の製剤を水溶性包装体に封入して供することも出来る。なお必要に応じて、製剤又は散布時に複数の他の除草剤、殺虫剤、殺菌剤、植物生長調整剤、肥料等と混合使用することも可能である。

固体担体としては、例えば石英、カオリナイト、パイロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライト及び珪藻

土等の天然鉱物質類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウム及び塩化カリウム等の無機塩類、合成珪酸ならびに合成珪酸塩が挙げられる。

液体担体としては、例えばエチレングリコール、プロピレングリコール及びイソプロパノール等のアルコール類、キシレン、アルキルベンゼン及びアルキルナフタレン等の芳香族炭化水素類、ブチルセロソルフ等のエーテル類、シクロヘキサノン等のケトン類、γ-ブチロラクトン等のエステル類、N-メチルピロリドン及びN-オクチルピロリドン等の酸アミド類、大豆油、ナタネ油、綿実油及びヒマシ油等の植物油ならびに水が挙げられる。

これら固体及び液体担体は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステル及びポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル等のノニオン性界面活性剤、アルキル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸及び燐酸塩、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸及び燐酸塩、ポリカルボン酸塩及びポリスチレンスルホン酸塩等のアニオン性界面活性剤、アルキルアミン塩及びアルキル4級アンモニウム塩等のカチオン性界面活性剤ならびにアミノ酸型及びペプチン型等の両性界面活性剤が挙げられる。

これら界面活性剤の含有量は、特に限定されるものではないが、本発明の製剤100重量部に対し、通常0.05～20重量部の範囲が望ましい。また、これら界面活性剤は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

次に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

〔水和剤〕

本発明化合物	0. 1 ~ 8 0 部
固体担体	5 ~ 9 8. 9 部
界面活性剤	1 ~ 1 0 部
その他	0 ~ 5 部

その他として、例えば固結防止剤、分解防止剤等があげられる。

〔乳 剤〕

本発明化合物	0. 1 ~ 3 0 部
液体担体	4 5 ~ 9 5 部
界面活性剤	4. 9 ~ 1 5 部
その他	0 ~ 1 0 部

その他として、例えば展着剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔懸濁剤〕

本発明化合物	0. 1 ~ 7 0 部
液体担体	1 5 ~ 9 8. 8 9 部
界面活性剤	1 ~ 1 2 部
その他	0. 0 1 ~ 3 0 部

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等が挙げられる。

〔顆粒水和剤〕

本発明化合物	0. 1 ~ 9 0 部
固体担体	0 ~ 9 8. 9 部
界面活性剤	1 ~ 2 0 部
その他	0 ~ 1 0 部

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔液 剤〕

本発明化合物	0. 0 1 ~ 7 0 部
液体担体	2 0 ~ 9 9. 9 9 部
その他	0 ~ 1 0 部

その他として、例えば凍結防止剤、展着剤等が挙げられる。

〔粒 剤〕

本発明化合物	0.01～80部
固体担体	10～99.99部
その他	0～10部

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔粉 剤〕

本発明化合物	0.01～30部
固体担体	65～99.99部
その他	0～5部

その他として、例えばドリフト防止剤、分解防止剤等が挙げられる。

使用に際しては上記製剤を水で1～10000倍に希釈して又は希釈せずに、有効成分が1ヘクタール (ha) 当たり0.001～50kg、好ましくは0.01～10kgになるように散布する。

製剤例

次に具体的に本発明化合物を有効成分とする農薬製剤例を示すがこれらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

〔配合例1〕水和剤

本発明化合物 No. 1	20部
バイロフィライト	74部
ソルポール 5039	4部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業 (株) 商品名)

カープレックス # 80D	2部
---------------	----

(合成含水珪酸：塩野義製薬 (株) 商品名)

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

〔配合例2〕乳 剤

本発明化合物 No. 1-1	5部
キシレン	75部
N-メチルピロリドン	15部

ソルボール 2 6 8 0

5 部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業(株) 商品名)

以上を均一に混合して乳剤とする。

〔配合例 3〕懸濁剤 (フロアブル剤)

本発明化合物 No. 1-1

2 5 部

アグリゾール S-710

1 0 部

(非イオン性界面活性剤：花王(株) 商品名)

ルノックス 1000C

0. 5 部

(アニオン性界面活性剤：東邦化学工業(株) 商品名)

キサントガム

0. 2 部

水

6 4. 3 部

以上を均一に混合した後、湿式粉碎して懸濁剤とする。

〔配合例 4〕顆粒水和剤 (ドライフロアブル剤)

本発明化合物 No. 1-1

7 5 部

ハイテノール NE 15

5 部

(アニオン性界面活性剤：第一工業製薬(株) 商品名)

バニレックス N

1 0 部

(アニオン性界面活性剤：日本製紙(株) 商品名)

カープレックス # 80D

1 0 部

(合成含水珪酸：塩野義製薬(株) 商品名)

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して顆粒水和剤とする。

〔配合例 5〕粒 剤

本発明化合物 No. 1-1

5 部

ベントナイト

5 0 部

タルク

4 5 部

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤とする。

〔配合例6〕粉 剤

本発明化合物 No. 1-1	3 部
カープレックス# 80D	0. 5 部
(合成含水珪酸：塩野義製薬 (株) 商品名)	
カオリナイト	9 5 部
リン酸ジイソプロピル	1. 5 部

以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。

使用に際しては上記水和剤、乳剤、フロアブル剤、粒状水和剤は水で50～1000倍に希釈して、有効成分が1ヘクタール(ha)当たり0.0001～10kgになるように散布する。

次に、本発明化合物の除草剤としての有用性を以下の試験例において具体的に説明する。

〔試験例-1〕湛水条件における雑草発生前処理による除草効果試験

内径3.2cm、深さ9cmの円筒形プラスチックカップ中に沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深4cmの湛水条件とする。上記のポットに2葉期のイネを移植し、更にノビエ、ホタルイ、コナギの種子を混播した。ポットを25～30℃の温室内において植物を育成し、播種後1日目に水面へ所定の薬量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を処理した。処理後3週間目に各種雑草に対する除草効果及びイネに及ぼす影響について下記の判定基準に従い目視により調査した。0は影響なし、5は完全枯死を示す5段階評価である。結果を第18表に示す。

なお、各表中のNo. は実施例に記載した化合物No. に対応し、記号は次の意味を示す。

A：ノビエ、B：ホタルイ、C：コナギ、a：イネ

判定基準

- 5…殺草率90%以上(ほとんど完全枯死)
- 4…殺草率70%以上90%未満
- 3…殺草率40%以上70%未満
- 2…殺草率20%以上40%未満

1…殺草率5%以上20%未満

0…殺草率5%未満(ほとんど効果なし)

〔試験例-2〕湛水条件における雑草発生後処理による除草効果試験

内径3.2cm、深さ9cmの円筒形プラスチックカップ中に沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深4cmの湛水条件とする。上記のポットにノビエ、ホタルイ、コナギの種子を混播した。ポットを25~30℃の温室内において植物を育成し、播種後14日目に水面へ所定の薬量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を処理した。処理後3週間目に各種雑草に対する除草効果について試験例-1の判定基準に従い目視により調査した。結果を第19表に示す。なお、各表中のNo.は実施例に記載した化合物No.に対応し、記号は次の意味を示す。

A:ノビエ、B:ホタルイ、C:コナギ

〔試験例-3〕土壌処理による除草効果試験

縦33cm、横33cm、深さ8cmのプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、メヒシバ、エノコログサ、カラスムギ、ブラックグラス、イチビ、ブタクサ、アオゲイトウ、シロザ、イヌタデ、オオイヌノフグリ、ハコベ、トウモロコシ、ダイズ、ワタ、コムギ、ビートの種子を混播、約1.5cm覆土した後、所定の薬量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を土壌表面へ均一に散布した。薬液散布後3週間目に各種雑草に対する除草効果及び作物に及ぼす影響について試験例-1の判定基準に従い目視により調査した。0は影響なし、5は完全枯死を示す5段階評価である。結果を第20表に示す。

なお、各表中のNo.は実施例に記載した化合物No.に対応し、記号は次の意味を示す。

D:メヒシバ、E:エノコログサ、F:カラスムギ、G:ブラックグラス、H:イチビ、I:ブタクサ、J:アオゲイトウ、K:シロザ、L:イヌタデ、M:オオイヌノフグリ、N:ハコベ、b:トウモロコシ、c:ダイズ、d:ワタ、e:コムギ、f:ビート

〔試験例-4〕茎葉処理による除草効果試験

縦33cm、横33cm、深さ8cmのプラスチック製箱に殺菌した洪積土

壤を入れ、メヒシバ、エノコログサ、カラスムギ、ブラックグラス、イチビ、ブタクサ、アオゲイトウ、シロザ、イヌタデ、オオイヌノフグリ、ハコベ、トウモロコシ、ダイズ、ワタ、コムギ、ビートの種子を混播、約1.5 cm覆土した後、25～30℃の温室において植物を14日間育成し、所定の薬量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を茎葉部へ均一に散布した。薬液散布後3週間目に各種雑草に対する除草効果及び作物に及ぼす影響について試験例-1の判定基準に従い目視により調査した。0は影響なし、5は完全枯死を示す5段階評価である。結果を第21表に示す。

なお、各表中のNo. は実施例に記載した化合物No. に対応し、記号は次の意味を示す。

D：メヒシバ、E：エノコログサ、F：カラスムギ、G：ブラックグラス、H：イチビ、I：ブタクサ、J：アオゲイトウ、K：シロザ、L：イヌタデ、M：オオイヌノフグリ、N：ハコベ、b：トウモロコシ、c：ダイズ、d：ワタ、e：コムギ、f：ビート

〔試験例-5〕 土壌処理による除草効果比較試験

縦33 cm、横33 cm、深さ8 cmのプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、メヒシバ、エノコログサ、シャターケーン、カップグラス、イチビ、ブタクサ、アオゲイトウ、シロザ、イヌタデ、オナモミ、アメリカアサガオ、チョウセンアサガオ、アメリカツナクサネム、トウモロコシ、ダイズ、ワタの種子を混播、約1.5 cm覆土した後、所定の薬量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を土壌表面へ均一に散布した。薬液散布後3週間目に各種雑草に対する除草効果及び作物に及ぼす影響について試験例-1の判定基準に従い目視により調査した。0は影響なし、5は完全枯死を示す5段階評価である。結果を第22表に示す。

なお、表中の化合物Aは本発明化合物No. 1-1を、化合物Bは特願平9-323974号公報に記載の化合物No. 233を表わし、記号は次の意味を示す。
D：メヒシバ、E：エノコログサ、O：シャターケーン、P：カップグラス、H：イチビ、I：ブタクサ、J：アオゲイトウ、K：シロザ、L：キハマスゲ、Q：オナモミ、R：アメリカアサガオ、S：チョウセンアサガオ、T：アメリカツ

ナクサネム、b：トウモロコシ、c：ダイズ、d：ワタ

[第18表]

表105

化合物 No.	薬量 g/a	A	B	C	a
1-1	2.52	5	4	5	0
1-3	0.64	5	5	5	1
1-4	0.64	5	5	5	1
1-5	2.52	5	5	5	0
1-6	2.52	5	5	5	0
1-7	2.52	5	5	5	0
1-8	2.52	5	5	5	0
1-9	2.52	5	5	5	1
1-10	0.64	5	5	5	3
1-11	0.64	5	5	5	3
1-12	0.64	5	5	5	2
1-13	2.52	5	2	5	0
1-14	2.52	5	1	5	0
1-15	0.64	5	4	5	0
1-16	2.52	5	1	1	0
1-17	2.52	5	4	4	0
1-20	2.52	4	3	1	0
1-21	0.64	5	5	5	3
1-22	0.64	5	5	5	1
1-32	0.64	1	0	2	0
1-33	0.64	5	1	5	0

表 1 0 6

化合物	薬量				
No.	g / a	A	B	C	a
1-34	0.64	5	3	5	1
1-35	0.64	3	2	3	0
1-36	2.52	4	0	4	0
1-37	0.64	5	5	5	4
1-39	0.64	4	0	4	0
1-41	0.64	5	0	5	0
1-42	2.52	5	4	5	0
1-44	0.64	5	4	5	0
1-45	0.64	5	5	5	0
1-46	0.64	5	2	5	0
1-47	2.52	5	5	5	0
1-48	0.64	5	3	5	0
1-49	0.64	5	5	5	4
1-50	0.64	5	3	5	0
1-51	2.52	5	3	5	0
1-52	0.64	3	5	5	0
1-53	0.64	5	5	5	0
1-54	0.64	5	5	5	5
1-57	0.64	5	4	5	0
1-58	2.52	5	5	5	1
1-59	2.52	4	3	4	0
1-60	0.64	5	5	5	0

表 107

化合物 No.	葉量 g / a	A	B	C	a
1-61	2.52	1	1	4	0
1-62	0.64	5	5	5	0
1-63	2.52	4	0	5	0
1-64	2.52	5	4	5	0
1-65	2.52	5	5	5	5
1-66	2.52	5	5	5	5
1-67	2.52	5	5	5	1
1-68	2.52	5	5	5	3
1-69	2.52	0	0	4	0
1-70	2.52	2	4	5	0
1-71	2.52	0	0	1	0
1-72	2.52	2	—	0	0
1-73	2.52	5	5	5	1
2-1	2.52	3	0	5	0
2-2	0.64	5	3	5	1
2-3	20	5	5	5	0
2-4	2.52	5	5	5	0
2-5	2.52	5	4	5	0
2-6	2.52	5	4	5	0
2-7	18.0	5	5	5	5
2-8	2.52	3	0	4	0
2-9	2.52	3	3	5	0

表 108

化合物 No.	薬量 g/a	A	B	C	a
2-10	2.52	2	4	5	0
2-11	10	5	5	5	4
2-12	10	4	3	5	0
2-13	10	5	5	5	0
2-14	10	4	4	5	3
3-1	2.52	5	5	5	5
3-2	2.52	5	5	5	5
3-3	2.52	5	5	5	4
3-4	2.52	5	5	5	5
3-5	2.52	5	5	5	5
3-6	2.52	5	5	5	5
3-7	2.52	5	5	5	5
3-8	2.52	5	5	5	5
3-9	2.52	5	5	5	4
3-10	2.52	5	5	5	4
3-11	2.52	5	5	5	4
3-12	2.52	5	5	5	2
3-13	2.52	5	5	5	5
3-14	2.52	5	5	5	5
3-15	2.52	5	5	5	5
3-16	10	5	5	5	2
3-17	10	5	5	5	5

表 109

化合物 No.	薬量 g / a	A	B	C	a
3-18	10	5	5	5	4
3-19	10	5	5	5	2
3-20	10	5	5	5	4
3-21	10	5	5	5	1
3-22	10	5	5	5	2
3-23	2.52	4	5	5	0
3-24	2.52	4	5	5	1
4-1	20	5	5	5	0
4-2	10	5	5	5	5
4-3	2.52	3	0	3	1
4-4	10	3	1	2	2
5-1	10	5	4	5	3
6-1	2.52	2	2	5	0
6-2	2.52	2	3	5	0
6-3	10	5	1	5	1
6-4	10	5	3	5	4
6-5	10	1	0	1	1
7-1	10	1	3	5	2

〔第 19 表〕

表 110

化合物 No.	薬量 g/a	A	B	C
1-1	2.52	0	0	5
1-3	0.64	5	5	5
1-4	0.64	5	5	5
1-6	2.52	5	1	4
1-7	2.52	5	3	4
1-8	2.52	5	5	5
1-9	2.52	5	0	5
1-10	0.64	5	0	5
1-11	0.64	5	0	4
1-12	0.64	5	0	4
1-13	2.52	5	4	5
1-14	2.52	2	2	3
1-15	0.64	4	3	3
1-17	2.52	2	1	1
1-21	0.64	5	5	5
1-22	0.64	5	3	5
1-34	0.64	4	3	5
1-35	0.64	3	0	0
1-37	0.64	5	3	5
1-41	2.52	5	4	5
1-44	2.52	4	2	3
1-45	0.64	5	3	4

表 1 1 1

化合物 No.	薬量 g/a	A	B	C
1-46	2.52	4	3	3
1-47	2.52	5	3	4
1-48	2.52	5	4	5
1-49	0.64	5	4	4
1-50	2.52	3	0	0
1-51	2.52	3	0	0
1-52	2.52	3	3	0
1-53	0.64	5	4	5
1-54	0.64	5	3	5
1-57	2.52	4	—	4
1-60	2.52	4	—	3
1-62	2.52	1	—	4
1-64	2.52	2	—	1
1-65	2.52	5	—	4
1-66	2.52	5	—	5
1-67	2.52	5	3	4
1-68	2.52	5	3	4
1-73	10	5	4	4
2-1	2.52	0	0	5
2-2	2.52	5	3	5
2-3	20	5	3	5
2-4	2.52	3	—	5

表 1 1 2

化合物	薬量			
No.	g/a	A	B	C
2-5	10	5	4	5
2-6	10	4	2	5
2-7	17.96	5	2	4
2-8	10	3	0	3
2-9	2.52	0	0	1
2-11	10	5	3	4
2-12	10	0	0	2
2-13	10	0	0	3
2-14	10	0	4	3
3-1	2.52	5	5	5
3-2	2.52	5	3	5
3-3	2.52	5	4	5
3-4	2.52	5	4	5
3-5	2.52	5	3	5
3-6	2.52	5	4	4
3-7	2.52	5	4	4
3-8	2.52	5	3	4
3-9	2.52	5	5	4
3-10	2.52	5	5	5
3-11	2.52	5	4	4
3-12	2.52	5	4	5
3-13	2.52	5	3	5

表 1 1 3

化合物	薬量			
No.	g / a	A	B	C
3-14	2.52	5	3	5
3-15	2.52	5	4	5
3-16	10	5	4	5
3-17	10	5	4	5
3-18	10	5	4	5
3-19	10	5	5	5
3-20	10	5	5	5
3-21	10	5	5	4
3-22	10	5	5	4
3-23	2.52	3	2	3
3-24	2.52	2	2	4
4-1	20	5	4	5
4-2	10	5	5	5
5-1	10	4	4	4
6-1	10	1	0	3
6-2	10	0	0	4
6-3	10	0	0	3
6-4	10	3	0	3
7-1	10	1	2	2

〔第 20 表〕

表 114

化合物 薬量																	
No.	g/a	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	b	c	d	e	f
1-1	6.3	5	5	0	1	5	5	0	5	3	0	0	1	0	0	0	1
1-3	1.6	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1-4	1.6	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	0	0	5	5
1-5	6.3	5	5	5	5	0	4	2	5	5	5	5	0	0	0	4	4
1-6	6.3	5	5	5	5	2	5	5	5	5	5	5	1	0	0	4	5
1-7	6.3	5	5	2	5	5	5	5	5	5	5	5	4	1	0	1	5
1-8	6.3	5	5	3	-	4	5	5	5	5	-	5	1	0	3	1	5
1-9	1.6	5	5	1	1	5	4	5	5	5	4	5	0	1	1	0	5
1-10	1.6	5	5	1	2	5	5	5	5	5	4	5	0	0	0	0	5
1-11	1.6	5	5	0	3	5	5	5	5	5	5	4	0	0	0	0	5
1-12	1.6	5	5	-	1	5	4	5	5	5	5	0	0	0	0	0	5
1-13	6.3	0	0	0	0	2	0	4	4	0	0	-	0	0	0	0	0
1-14	6.3	0	4	0	0	0	0	3	5	0	5	4	0	0	0	0	5
1-15	6.3	5	5	0	0	4	4	5	5	5	0	0	0	0	0	0	1
1-16	6.3	5	4	1	1	0	2	5	5	5	1	5	2	1	0	0	5
1-17	6.3	2	0	0	0	0	4	3	4	0	3	5	0	1	0	0	5
1-19	6.3	0	0	0	0	0	0	0	2	4	-	5	0	0	0	0	5
1-20	6.3	0	0	0	0	0	0	4	5	3	0	1	0	0	0	0	0
1-21	1.6	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1-22	1.6	5	5	-	5	5	4	5	5	5	5	5	2	0	0	0	5
1-33	6.3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	3	0	0	0	0	0
1-34	6.3	5	5	3	2	5	4	4	5	5	0	5	3	1	1	0	5

表 1 1 5

化合物 薬量																	
No.	g/a	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	b	c	d	e	f
1-35	6.3	4	4	1	1	5	5	2	5	1	5	5	0	0	2	-	2
1-36	6.3	0	5	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
1-37	1.6	5	5	3	5	5	5	5	5	5	5	5	2	0	0	0	5
1-38	6.3	0	-	-	-	0	0	-	-	-	-	5	0	0	0	0	0
1-39	6.3	0	2	-	-	4	4	5	-	5	1	4	0	0	0	0	5
1-40	25	1	2	-	0	0	4	0	-	5	5	5	0	0	0	0	5
1-41	1.6	2	5	0	-	5	4	5	-	5	5	5	1	0	0	0	5
1-42	6.3	0	2	5	0	2	3	5	-	0	5	5	0	0	0	0	5
1-44	6.3	3	5	0	2	5	5	5	-	5	3	5	0	0	0	0	3
1-45	6.3	4	5	3	4	5	5	5	-	5	5	5	1	0	0	0	5
1-46	1.6	5	5	0	0	3	5	5	-	5	5	5	0	0	0	0	0
1-47	6.3	5	5	0	4	0	5	5	-	5	5	0	0	0	0	0	0
1-48	6.3	5	5	4	4	1	5	4	-	5	5	5	0	0	0	0	5
1-49	1.6	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	2	5	5
1-50	6.3	0	1	2	5	0	2	2	0	-	5	5	0	0	0	0	5
1-51	6.3	3	4	0	0	0	0	2	5	-	0	5	0	0	0	0	0
1-52	6.3	1	5	0	-	0	2	4	5	5	0	0	0	0	0	0	0
1-53	1.6	5	5	1	-	5	2	5	5	5	3	0	4	0	0	0	2
1-54	1.6	5	5	4	5	5	4	5	5	3	3	5	3	1	2	0	5
1-56	6.3	1	4	0	0	0	0	0	5	5	0	0	0	0	0	0	0
1-57	6.3	4	-	2	5	5	5	5	5	5	5	5	4	0	1	1	5
1-58	6.3	4	3	0	3	1	3	5	5	5	4	5	0	0	0	0	5

表 1 1 6

化合物 薬量																	
No.	g/a	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	b	c	d	e	f
1-59	6.3	2	5	0	0	1	0	2	5	5	0	5	2	0	0	0	5
1-60	6.3	2	1	3	5	4	-	5	5	5	1	4	0	0	0	0	5
1-61	6.3	0	0	0	0	0	1	3	3	5	2	1	0	0	0	0	0
1-62	6.3	5	5	4	0	2	2	4	5	-	5	5	0	0	0	0	5
1-63	6.3	5	5	0	4	3	2	5	5	5	5	5	2	0	0	1	5
1-64	6.3	5	5	1	4	5	4	4	5	5	5	4	1	0	0	1	5
1-65	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	3	5	5
1-66	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	4	4	5
1-67	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	3	5	5
1-68	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	3	4	5
1-69	6.3	0	0	0	0	1	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0
1-70	6.3	0	0	0	0	1	1	0	0	3	0	0	0	0	0	0	0
1-73	25	5	5	1	4	5	4	5	5	5	5	4	3	1	3	0	5
2-1	6.3	1	1	1	0	5	5	0	5	3	4	4	0	0	0	0	5
2-2	6.3	4	5	0	4	5	5	4	5	0	5	5	0	0	0	0	3
2-3	50	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	0	1	1	5
2-4	6.3	4	5	1	2	5	5	5	-	4	5	5	3	0	2	0	5
2-5	6.3	3	4	1	1	5	5	5	-	5	5	5	0	0	4	0	4
2-6	6.3	0	-	2	1	1	2	0	-	0	5	5	0	0	0	0	5
2-7	44.9	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	0	0	4	5
2-8	6.3	0	2	-	0	2	5	2	4	-	5	5	0	0	0	-	5
2-9	6.3	0	2	0	0	1	3	2	5	5	2	4	0	0	0	0	5

表 1 1 7

化合物 薬量																	
No.	g/a	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	b	c	d	e	f
2-10	6.3	0	0	0	-	0	1	0	5	2	0	1	0	0	0	0	0
2-11	25	4	4	3	3	5	5	5	5	5	5	4	5	2	2	3	5
2-12	25	2	2	0	2	5	4	4	4	4	5	5	2	0	0	1	5
2-13	25	4	4	0	0	5	5	5	5	4	5	5	3	0	1	2	5
2-14	25	4	1	0	0	5	3	4	5	5	4	4	0	0	0	0	2
3-1	1.6	5	5	3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	0	0	1	5
3-2	6.3	5	5	2	4	5	5	3	5	5	5	5	3	2	3	2	5
3-3	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
3-4	6.3	5	5	3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	3	5
3-5	6.3	5	5	1	2	5	5	5	5	5	5	5	5	1	2	-	5
3-6	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	3	5	5
3-7	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
3-8	6.3	5	5	1	1	5	5	5	5	5	3	4	5	1	1	1	5
3-9	6.3	4	4	-	2	4	3	5	5	4	5	5	0	0	0	0	5
3-10	6.3	5	5	2	5	5	5	5	5	5	5	5	1	0	3	1	5
3-11	6.3	5	4	5	5	5	5	4	5	4	5	4	2	0	1	4	5
3-12	6.3	4	4	4	5	5	4	3	5	5	5	5	3	1	2	4	5
3-13	6.3	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	2	3	3	5
3-14	6.3	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	1	3	3	5
3-15	6.3	5	5	4	5	5	5	4	5	5	5	5	5	3	5	3	5
3-16	25	5	5	2	4	5	5	5	5	5	5	4	1	3	1	5	5
3-17	25	5	5	4	3	5	5	5	5	5	5	5	1	2	5	2	5

表 1 1 8

化合物 薬量																	
No.	g/a	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	b	c	d	e	f
3-18	25	5	5	3	2	5	5	5	5	5	5	5	3	2	4	3	5
3-19	25	5	5	5	4	5	5	4	5	-	5	5	4	0	2	4	5
3-20	25	5	5	4	4	5	5	5	5	-	5	5	4	0	1	4	5
3-21	25	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	5	4	1	1	1	5
3-22	25	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	4	1	1	4	5
3-23	6.3	4	3	0	0	5	2	4	4	4	1	1	0	0	0	0	5
3-24	6.3	4	1	0	0	5	3	5	5	5	1	1	0	0	0	0	2
4-1	50	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
4-2	25	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	2	5	5	5
4-3	6.3	1	1	0	0	3	2	1	5	-	1	2	0	1	1	0	2
4-4	25	4	3	0	0	2	2	0	4	5	3	4	0	0	0	0	4
5-1	25	4	4	1	2	5	5	4	5	4	5	5	2	0	0	1	5
6-1	6.3	2	1	0	0	5	1	3	5	-	1	5	0	0	0	0	5
6-2	6.3	0	0	0	0	3	5	1	5	1	5	5	0	0	0	0	5
6-3	25	5	4	1	4	5	4	4	5	5	5	5	1	1	1	0	5
6-4	25	5	4	0	3	5	5	5	5	5	5	4	4	1	0	0	5
6-5	25	2	2	0	0	4	3	3	4	0	2	5	0	0	0	0	5
7-1	25	1	0	0	0	3	4	3	5	-	4	4	0	0	0	0	2

〔第 2 1 表〕

表 1 1 9

化合物 薬量																	
No.	g/a	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	b	c	d	e	f
1-1	6.3	4	5	1	2	5	5	1	5	4	5	3	2	2	1	0	0
1-3	1.6	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1-4	1.6	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5
1-5	6.3	5	5	4	4	1	4	0	4	4	5	3	4	0	1	3	1
1-6	6.3	5	5	5	4	5	5	2	5	5	5	5	4	2	1	4	3
1-7	6.3	4	3	2	3	5	4	5	5	3	5	5	3	2	2	3	3
1-8	6.3	4	4	5	3	5	5	5	5	3	5	5	2	3	4	2	5
1-9	1.6	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	5	2	4	5	2	5
1-10	1.6	5	5	3	4	5	5	5	5	5	5	5	1	3	5	2	5
1-11	1.6	5	5	2	4	5	5	5	5	5	5	5	1	2	5	0	5
1-12	1.6	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	2	3	5	2	5
1-13	6.3	4	4	1	2	5	5	5	5	5	5	5	0	2	5	0	5
1-14	6.3	3	5	1	3	5	5	5	5	5	5	5	2	2	4	1	5
1-15	6.3	4	4	1	1	5	3	3	5	3	2	1	1	0	0	0	0
1-16	6.3	0	0	3	2	2	3	3	5	3	5	5	1	0	0	1	2
1-17	6.3	0	0	1	3	0	3	3	5	2	5	5	0	0	0	0	5
1-18	6.3	0	0	1	1	3	0	0	2	-	4	5	0	0	0	0	1
1-19	6.3	0	0	1	2	0	1	2	2	1	0	5	0	0	0	0	1
1-20	1.6	1	2	1	1	4	3	4	4	4	5	5	2	0	0	0	3
1-21	1.6	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	2	4	2	3
1-22	1.6	5	5	1	2	5	5	5	5	5	5	5	1	1	3	0	3
1-32	6.3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	3	0	1	0	0	2

表 1 2 0

化合物 薬量																	
No.	g/a	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	b	c	d	e	f
1-33	6.3	4	4	1	1	5	5	3	5	2	3	5	2	0	0	-	0
1-34	1.6	5	5	1	1	5	5	4	5	5	5	4	2	4	5	-	4
1-35	6.3	4	4	1	1	5	5	2	5	1	5	5	0	0	2	-	2
1-36	6.3	1	1	1	2	5	5	4	5	3	5	5	0	0	1	0	1
1-37	1.6	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	2	5	5	0	5
1-38	1.6	2	2	2	1	5	2	3	5	3	5	5	0	0	5	0	1
1-39	6.3	2	2	4	2	5	5	5	-	4	5	5	1	3	2	0	0
1-40	6.3	0	1	1	4	5	5	5	-	2	5	4	0	0	4	0	1
1-41	1.6	5	5	4	4	5	5	5	-	5	5	5	3	5	5	3	5
1-42	6.3	2	3	1	4	5	5	5	-	5	5	5	0	-	1	0	2
1-43	6.3	0	0	0	0	4	4	1	-	2	0	1	0	0	0	0	1
1-44	6.3	2	5	2	2	5	5	4	-	5	-	4	1	1	2	1	0
1-45	1.6	2	3	2	0	5	5	5	-	5	5	5	0	0	5	0	1
1-46	6.3	5	5	2	2	5	5	2	-	5	5	2	1	1	1	-	1
1-47	1.6	3	5	2	3	5	4	4	-	5	5	2	0	1	1	0	1
1-48	1.6	4	5	2	3	5	5	4	-	5	4	3	0	1	5	0	4
1-49	1.6	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	1	5
1-50	1.6	1	5	2	2	4	5	5	5	2	5	5	0	0	2	0	5
1-51	1.6	2	2	0	1	4	5	4	4	4	5	5	0	0	0	0	0
1-52	6.3	1	1	0	0	5	5	4	5	-	3	5	0	1	1	0	0
1-53	1.6	4	4	1	3	5	-	4	5	5	5	5	1	1	2	0	1
1-54	1.6	5	5	3	5	5	5	5	5	5	5	5	2	1	5	0	2

表 1 2 1

化合物 薬量																	
No.	g/a	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	b	c	d	e	f
1-55	6.3	0	0	1	1	5	2	4	5	2	4	4	1	0	2	0	2
1-56	6.3	2	2	0	0	0	1	2	5	0	-	0	0	0	0	0	5
1-57	1.6	2	-	0	3	5	5	5	5	5	5	5	0	1	4	0	5
1-58	1.6	1	0	4	5	5	5	5	5	5	5	5	0	0	5	0	5
1-59	6.3	4	5	3	0	5	5	5	5	5	5	5	2	1	5	0	5
1-60	6.3	1	-	1	2	5	5	5	5	5	5	5	2	0	5	0	5
1-61	6.3	1	1	0	0	0	1	2	5	1	4	3	0	0	0	0	2
1-62	1.6	2	-	2	0	5	3	5	5	5	5	5	0	1	5	0	5
1-63	6.3	4	4	2	5	5	5	2	5	3	5	5	1	1	1	1	5
1-64	6.3	5	5	1	4	5	4	4	5	5	5	4	1	0	0	1	5
1-65	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
1-66	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1-67	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
1-68	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
1-69	6.3	0	0	0	0	0	1	0	4	0	0	0	0	0	0	0	0
1-70	6.3	0	0	0	0	2	2	1	2	1	1	4	0	0	0	0	1
1-73	25	5	5	1	4	5	4	5	5	5	5	4	3	1	3	0	5
2-1	1.6	4	4	1	1	5	5	4	5	4	5	5	2	2	3	0	2
2-2	6.3	4	4	3	3	5	5	4	5	5	5	5	4	2	5	1	5
2-3	50	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	1	1	4	0	2
2-4	6.3	4	5	2	3	5	5	5	-	5	5	5	1	5	5	0	2
2-5	6.3	1	4	2	3	5	5	5	5	5	5	5	5	2	5	0	5

表 1 2 2

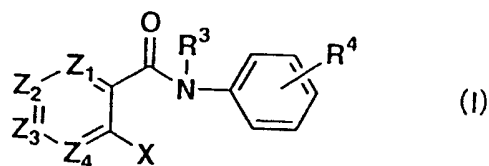
化合物 薬量																	
No.	g/a	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	b	c	d	e	f
2-6	6.3	3	4	1	1	5	-	3	-	3	5	4	0	1	5	0	3
2-7	44.9	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	2	5	4	5
2-8	6.3	2	2	1	2	4	5	2	5	5	2	5	0	0	0	0	0
2-9	6.3	2	5	1	0	5	5	4	5	5	2	5	0	0	1	0	5
2-10	6.3	1	3	0	3	4	5	3	5	5	5	5	0	0	2	0	5
2-11	25	3	4	4	5	5	5	4	5	5	5	5	4	2	2	3	5
2-12	25	1	1	1	1	5	5	2	5	4	4	5	1	1	2	1	5
2-13	25	2	1	1	1	5	5	3	5	4	4	5	3	3	2	1	5
2-14	25	3	2	0	0	5	4	3	5	2	4	5	0	2	2	0	5
3-1	1.6	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	2	5
3-2	6.3	5	5	2	4	5	5	3	5	5	5	5	3	2	3	2	5
3-3	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
3-4	6.3	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5
3-5	6.3	5	5	2	3	5	5	2	5	3	5	5	3	2	3	2	5
3-6	6.3	5	5	5	5	5	5	3	5	5	5	5	4	4	3	4	5
3-7	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	4	4	5
3-8	6.3	4	4	1	4	5	5	3	5	5	3	5	4	2	2	1	5
3-9	6.3	5	5	2	1	5	5	5	5	5	5	5	2	2	5	0	5
3-10	6.3	4	4	3	3	5	5	5	5	5	5	5	3	4	5	2	5
3-11	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
3-12	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	5	5
3-13	6.3	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5

表 1 2 3

化合物 薬量																	
No.	g/a	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	b	c	d	e	f
3-14	6.3	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	4	5
3-15	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5
3-16	25	5	5	4	3	5	4	4	5	5	5	5	4	4	5	1	5
3-17	25	5	5	2	4	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	3	5
3-18	25	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	3	5
3-19	25	5	5	4	3	5	5	4	5	5	5	5	4	3	4	1	4
3-20	25	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	5	4	2	5	3	5
3-21	25	5	5	4	4	5	5	4	5	5	5	5	4	4	4	2	4
3-22	25	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	3	5	3	5
3-23	6.3	3	3	0	0	5	3	4	5	3	1	4	1	1	1	0	5
3-24	6.3	3	2	0	0	5	3	4	4	5	2	2	1	1	1	0	5
4-1	50	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
4-2	25	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	5	5	4	5
4-3	6.3	2	1	0	1	5	2	3	5	-	5	5	1	3	5	1	4
4-4	25	4	2	0	1	5	3	3	5	4	5	5	2	2	4	1	5
5-1	25	5	4	1	4	5	5	5	5	5	5	5	1	3	5	1	5
6-1	6.3	1	1	1	2	5	5	5	5	-	5	5	1	3	5	1	5
6-2	6.3	1	1	1	3	5	5	3	5	5	5	5	2	3	5	1	5
6-3	25	4	4	2	4	5	4	4	5	4	5	5	1	2	5	0	5
6-4	25	4	4	2	5	5	5	5	5	5	5	5	2	3	5	1	5
6-5	25	1	1	0	0	4	4	1	4	1	1	5	1	2	2	0	5
7-1	25	2	1	0	0	5	5	4	5	3	5	5	0	2	1	1	5

請求の範囲

1. 式 (I) :



[式中、 $=Z^1 \sim Z^4=$ は $=C(R^2) - C(R^{22}) = N - N=$ 、 $=C(R^2) - N = C(R^1) - C(R^{23}) =$ 、 $=C(R^2) - N(\rightarrow O) = C(R^1) - C(R^{23}) =$ 、 $=C(R^2) - N = C(R^1) - N=$ 、 $=C(R^2) - N = N - C(R^{23}) =$ 、 $=N - N = C(R^1) - C(R^{23}) =$ 又は $=N - C(R^{22}) = N - C(R^{23}) =$ を表わし、

R^1 、 R^2 、 R^{22} 及び R^{23} は同一でも相異なってもよく、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル基、Aで置換されていてもよいフェニル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニル $C_2 \sim C_4$ アルケニル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニル $C_2 \sim C_4$ アルキニル基、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $-CO_2R^7$ 基、 $-(C(R^5)R^6) - CO_2R^7$ 基、 $-(C(R^5)R^6)_2 - CO_2R^7$ 基、 $-(C(R^5)R^6)_3 - CO_2R^7$ 基、 $-(C(R^5)R^6)_4 - CO_2R^7$ 基、 $-CN$ 基、 $-(C(R^5)R^6) - CN$ 基、 $-(C(R^5)R^6)_2 - CN$ 基、 $-(C(R^5)R^6)_3 - CN$ 基、 $-(C(R^5)R^6)_4 - CN$ 基、 $-N(R^8)R^9$ 基、 $-(C(R$

⁵) R⁶) -N (R⁸) R⁹基、- (C (R⁵) R⁶)₂-N (R⁸) R⁹基、- (C (R⁵) R⁶)₃-N (R⁸) R⁹基、- (C (R⁵) R⁶)₄-N (R⁸) R⁹基、-L-R¹⁰基、C₁~C₆アルキルカルボニル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニルC₁~C₄アルキルカルボニル基、C₁~C₆ジアルキルカルバモイル基、C₁~C₆アルキルスルホニル基又は、C₁~C₆ジアルキルスルファモイル基を表わし、

R³は水素原子、C₁~C₆アルキル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニルC₁~C₄アルキル基、C₁~C₆アルキルカルボニル基、フェニル基がAで置換されていてもよいベンゾイル基、C₁~C₆アルコキシC₁~C₆アルキル基又はC₁~C₆アルコキシカルボニル基を表わし、

Aは水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、C₁~C₆アルキル基、C₁~C₆ハロアルキル基、C₁~C₆アルコキシ基、C₁~C₆ハロアルコキシ基、C₁~C₆アルコキシカルボニル基、C₁~C₆アルキルカルボニル基、フェニル基、フェノキシ基、ベンジル基、C₁~C₄アルキルカルボニルアミノ基、C₁~C₄アルコキシカルボニルアミノ基、C₁~C₆アルキルチオ基及びC₁~C₆アルキルスルホニル基から選ばれる同一又は相異なった1以上の基を表わし、

R⁴は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、C₁~C₆アルキル基、C₁~C₆ハロアルキル基、C₁~C₆アルコキシ基、C₁~C₆ハロアルコキシ基、C₁~C₆アルコキシカルボニル基、C₁~C₆アルキルカルボニル基、フェニル基、フェノキシ基、ベンジル基、C₁~C₄アルキルカルボニルアミノ基、C₁~C₄アルコキシカルボニルアミノ基、C₁~C₆アルキルチオ基及びC₁~C₆アルキルスルホニル基から選ばれる同一又は相異なった1以上の基を表わし、

R⁵及びR⁶は同一でも相異なってもよく、水素原子又はC₁~C₄アルキル基を表わし、

R⁷は水素原子、C₁~C₆アルキル基又はC₁~C₆シクロアルキル基を表わし、

R⁸及びR⁹は同一でも相異なってもよく、水素原子、C₁~C₁₀アルキル基、C₂~C₁₀アルケニル基、C₂~C₁₀アルキニル基、C₁~C₁₀ハロアルキル基、C₂~C₁₀ハロアルケニル基、C₂~C₁₀ハロアルキニル基、C₃~C₁₀シクロアルキル基、C₃~C₁₀ハロシクロアルキル基、C₁~C₆アルコキシC₁~C₆アルキル基、

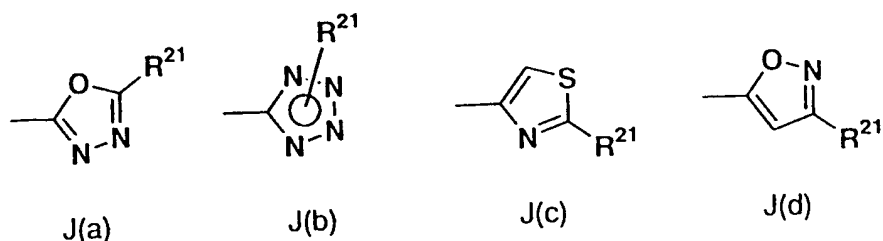
C₁~C₆アルキルチオC₁~C₆アルキル基、C₁~C₄アルキルカルボニル基、C₁~C₄アルコキシカルボニル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニルC₁~C₄アルキルカルボニル基、シアノ基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニルC₁~C₄アルキル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニルC₁~C₄アルケニル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニルC₁~C₄アルキニル基、C₁~C₄アルキルスルホニル基又はC₁~C₄ジアルキルスルファモイル基を表わし、

R⁸及びR⁹は結合する窒素原子とともに3~9員環を形成していてもよく、1若しくは2の酸素原子又は1若しくは2の硫黄原子を含む5~8員環を形成していてもよく、

Lは酸素原子又はイオウ原子を表わし、

R¹⁰は水素原子、C₁~C₆アルキル基、C₁~C₆ハロアルキル基、C₁~C₆シクロアルキル基、C₂~C₆アルケニル基、C₂~C₆ハロアルケニル基、C₂~C₆アルキニル基、C₂~C₆ハロアルキニル基、C₁~C₄アルコキシC₁~C₄アルキル基、C₁~C₄アルキルチオC₁~C₄アルキル基、-CO₂R⁷基、-(C(R⁵)R⁶)-CO₂R⁷基、-(C(R⁵)R⁶)₂-CO₂R⁷基、-(C(R⁵)R⁶)₃-CO₂R⁷基、-(C(R⁵)R⁶)₄-CO₂R⁷基、Aで置換されていてもよいフェニル基、Aで置換されていてもよいフェニルC₁~C₄アルキル基、シアノC₁~C₄アルキル基、-CON(R⁸)R⁹基、-(C(R⁵)R⁶)-CON(R⁸)R⁹基、-(C(R⁵)R⁶)₂-CON(R⁸)R⁹基、-(C(R⁵)R⁶)₃-CON(R⁸)R⁹基又は-(C(R⁵)R⁶)₄-CON(R⁸)R⁹基を表わし、

Xは-CO-L-R¹¹基、-C(=L)N(R¹²)R¹³基、-C(=L)-N(R¹²)-OR¹³基、-C(=L)N(R¹⁴)-N(R¹²)R¹³基、-C(=L)N(R¹⁵)-CO₂R¹⁸基、-C(=L)N(R¹⁵)-(C(R¹⁶)R¹⁷)-CO₂R¹⁸基、-C(=L)N(R¹⁵)-(C(R¹⁶)R¹⁷)₂-CO₂R¹⁸基、-C(=L)N(R¹⁵)-(C(R¹⁶)R¹⁷)₃-CO₂R¹⁸基、-C(R¹⁹)=N-O-R²⁰基、-C(=L)NH-G基、シアノ基、-CO-R¹⁹基、J(a), J(b), J(c)又はJ(d)



を表わし、

R^{11} は水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル基、Aで置換されていてもよいフェニル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基を表わし、

R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} は同一でも相異なってもよく、水素原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル基、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル基、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル基、 $C_2 \sim C_{10}$ ハロアルケニル基、 $C_2 \sim C_{10}$ ハロアルキニル基、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル基、ヒドロキシ $C_1 \sim C_{10}$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル基、シアノ基、Aで置換されていてもよいフェニル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_4$ アルケニル基、フェニル基がAで置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_4$ アルキニル基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基又は $C_1 \sim C_4$ ジアルキルスルファモイル基を表わし、

R^{12} 及び R^{13} は結合する窒素原子又は酸素原子とともに3～9員環を形成していてもよく、1若しくは2の酸素原子又は若しくは2の硫黄原子を含む5～8員環を形成していてもよく、

R^{16} 及び R^{17} は同一でも相異なってもよく、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、Aで置換されていてもよいフェニル基、フェニル基がAで置換されていても

よいフェニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基又は $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ $C_1 \sim C_4$ アルキル基を表わし、

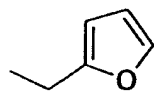
R^{16} 及び R^{17} は結合する炭素原子とともに 4 ～ 9 員環を形成していてもよく、

R^{18} は水素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキル基を表わし、

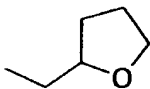
R^{19} は水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、A で置換されていてもよいフェニル基又はフェニル基が A で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基を表わし、

R^{20} は水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、シアノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基又は $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表わし、

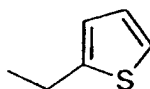
G は G (a) , G (b) , G (c) 又は G (d) のいずれかの構造



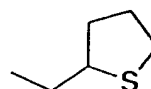
G(a)



G(b)



G(c)



G(d)

を表わし、

R^{21} は水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基又は $C_1 \sim C_6$ シクロアルキル基を表わす。]

で示される化合物、及びその塩。

2. $=Z^1 \sim Z^4 =$ が $=C(R^2) - N=C(R^1) - N=$ の結合様式を表わし、

R^1 が $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、A で置換されていてもよいフェニル基、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基、 $-N(R^8)R^9$ 基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基又は $C_2 \sim C_6$ アルキニル基を表わし、

R^2 が水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ

$C_1 \sim C_6$ アルキル基、ハロゲン原子、シアノ基、 $-N(R^8)R^9$ 基、 $-L-R^{10}$ 基又はAで置換されていてもよいフェニル基を表わし、

R^3 が水素原子を表わし、

R^4 が同一でも相異なっているもよく、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基を表わし、

Xが $-C(=O)N(R^{12})R^{13}$ 基(R^{12} 及び R^{13} は同一でも相異なっているもよく、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル基又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基を表わす。)、 $-C(=O)N(R^{12})OR^{13}$ 基又は、 $-C(=O)-N(R^{14})-N(R^{12})R^{13}$ 基を表わす請求項1記載の化合物。

3. $=Z^1 \sim Z^4=$ が $=C(R^2)-N=C(R^1)-C(R^{23})=$ の結合様式を表わし、

R^2 が水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基又は $-N(R^8)R^9$ 基(R^8 及び R^9 は同一でも相異なっているもよく、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表わす。)を表わし、

R^1 及び R^{23} が同一でも相異なっているもよく、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基又は $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表わし、

Xが $-C(=O)N(R^{12})R^{13}$ 基を表わす請求項1記載の化合物。

4. $=Z^1 \sim Z^4=$ が $=C(R^2)-C(R^{22})=N-N=$ の結合様式を表わし、

R^2 及び R^{22} が同一でも相異なっているもよく、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基又は $-N(R^8)R^9$ 基(R^8 及び R^9 は同一でも相異なっているもよく、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表わす。)を表わし、

Xが $-C(=O)N(R^{12})R^{13}$ 基を表わす請求項1記載の化合物。

5. R^1 が水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基又は $-N(R^8)R^9$ 基を表わす請求項2記載の化合物。

6. R^1 がメチル基、トリフルオロメチル基、メチルチオ基、メトキシ基、エトキシ基、シアノ基又はジメチルアミノ基を表わす、請求項5記載の化合物。
7. 請求項1記載の化合物を含有することを特徴とする農薬。
8. 請求項1記載の化合物を含有することを特徴とする除草剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP99/01048

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER Int.Cl ⁶ C07D213/89, C07D213/82, C07D239/26, C07D239/34, C07D239/42, C07D237/24, C07D239/52, A01N43/54, A01N43/40, A01N43/58 According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) Int.Cl ⁶ C07D213/00-89, C07D239/00-52, C07D237/00-24, A01N43/00-58 Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) REGISTRY (STN), CAPLUS (STN), WPIDS (STN)		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP, 422456, A2 (BASF A.G.), 17 April, 1991 (17. 04. 91) (Family: none)	1-8
A	JP, 9-323974, A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 16 December, 1997 (16. 12. 97) & EP, 799825, A1 & US, 5843868, A	1-8
A	JP, 1-180804, A (Daicel Chemical Industries, Ltd.), 18 July, 1989 (18. 07. 89) (Family: none)	1-8
X	Chemical Abstracts, Abstract No. 115:49341 HUSSEIN, S.H.; AHMED, B.A.; AL-KATTAN, W.T.; AL-RAWI, J.M.A. A new method for the synthesis of N,N'-disubstituted picolinic amides. Asian J. Chem., Vol. 3, No. 1, p.52-57 (1991) See Registry No. 94301-64-1(3,4-pyridinedicarboxanilide), 134852-18-9(N,N'-bis(4-ethylphenyl)-3,4-pyridine-dicarboxamide), 134852-19-0(N,N'-bis(2,5-dimethoxyphenyl)-3,4-pyridine-dicarboxamide)	1, 3
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed		"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family
Date of the actual completion of the international search 24 May, 1999 (24. 05. 99)		Date of mailing of the international search report 8 June, 1999 (08. 06. 99)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office		Authorized officer
Facsimile No.		Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP99/01048

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	CHIMICHI, S.; NESI, R.; NERI, M. Pyridazine-4,5-dicarboxylic anhydride: vesatile synthon for the preparation of 1,3,7,8-tetraazaspiro[4.5]decane-derivatives with nitrogen 1,3-binucleopholes. J. Chem. Soc., Perkin Trans. I, No. 11, p.2491-2495 (1984)	1
X A	OHTA, H.; SUZUKI, S.; WATANABE, H.; JIKIHARA, T.; MATSUYA, K.; WAKABAYASHI, K. Structure-activity relationship of cyclic imide herbicides. I.N-substituted phenyl-3,4,5,6-tetrahydro-phthalimides and related compounds. Agric. Biol. Chem., Vol. 40, No. 4, p.745-751 (1976)	1 7, 8

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP99/01048

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl. ⁸ C07D213/89, C07D213/82, C07D239/26, C07D239/34, C07D239/42, C07D237/24, C07D239/52, A01N43/54, A01N43/40, A01N43/58

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl. ⁸ C07D213/00-89, C07D239/00-52, C07D237/00-24, A01N43/00-58

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)
REGISTRY (STN), CAPLUS (STN), WPIDS (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	EP, 422456, A2 (BASF A. G.) 17. 4月. 1991 (17. 04. 91) ファミリーなし	1-8
A	JP, 9-323974, A (日本農薬株式会社) 16. 12月. 1997 (16. 12. 97) &EP, 799825, A1 &US, 5843868, A	1-8
A	JP, 1-180804, A (ダイセル化学工業株式会社) 18. 7月. 1989 (18. 07. 89) ファミリーなし	1-8

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

24. 05. 99

国際調査報告の発送日

08.06.99

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

齋藤 恵

印

4 P

9164

電話番号 03-3581-1101 内線 3490

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	<p>Chmical Abstracts, Abstract No. 115:49341 HUSSEIN, S. H. ; AHMED, B. A. ; AL-KATTAN, W. T. ; AL-RAWI, J. M. A. A new method for the synthesis of N,N'-disubstituted picolinic amides. Asian J. Chem. , Vol. 3, No. 1, p. 52-57 (1991)</p> <p>See Registry No. 94301-64-1 (3,4-pyridinedicarboxanilide), 134852-18-9 (N,N'-bis(4-ethylphenyl)-3,4-pyridine- dicarboxamide), 134852-19-0 (N,N'-bis(2,5-dimethoxyphenyl)-3,4-pyridine- dicarboxamide)</p>	1, 3
X	<p>CHIMICHI, S. ; NESI, R. ; NERI, M. Pyridazine-4,5-dicarboxylic anhydride: vesatile synthon for the preparation of 1,3,7,8-tetraazaspiro[4.5]decane- derivatives with nitrogen 1,3-binucleopholes. J. Chem. Soc. , Perkin Trans. I, No. 11, p. 2491-2495 (1984)</p>	1
X A	<p>OHTA, H. ; SUZUKI, S. ; WATANABE, H. ; JIKIHARA, T. ; MATSUYA, K. ; WAKABAYASHI, K. Structure-activity reraltionship of cyclic imide herbicides. I. N-substituted phenyl-3,4,5,6-tetrahydro- phthalimides and related compounds. Agric. Biol. Chem. , Vol. 40, No. 4, p. 745-751 (1976)</p>	1 7, 8